

Europäisches Patentamt
European Patent Office
Office européen des brevets



Veröffentlichungsnummer: 0 617 026 A1

(12)

EUROPÄISCHE PATENTANMELDUNG

(21) Anmeldenummer: 94103880.4

(51) Int. Cl.⁵ C07D 249/14, C07D 401/12,
C07D 405/12, C07D 409/12,
A01N 43/653

(22) Anmeldetag: 14.03.94

(30) Priorität: 26.03.93 DE 4309966

D-51375 Leverkusen (DE)

Erfinder: Haas, Wilhelm, Dr.

Schürgespfad 19

D-50259 Pulheim (DE)

Erfinder: Schallner, Otto, Dr.

Noldeweg 22

D-40789 Monheim (DE)

Erfinder: König, Klaus, Dr.

Zum Hahnenberg 40

D-51519 Odenthal (DE)

Erfinder: Santel, Hans-Joachim, Dr.

Grünstrasse 9a

D-51371 Leverkusen (DE)

Erfinder: Dollinger, Markus, Dr.

Burscheider Strasse 154b

D-51381 Leverkusen (DE)

(43) Veröffentlichungstag der Anmeldung:
28.09.94 Patentblatt 94/39

(84) Benannte Vertragsstaaten:
BE CH DE DK ES FR GB IT LI NL

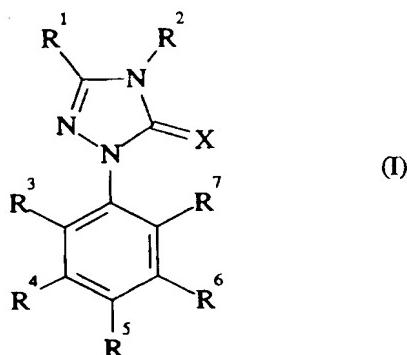
(71) Anmelder: BAYER AG

D-51368 Leverkusen (DE)

(72) Erfinder: Linker, Karl-Heinz
Albert-Schweitzer-Strasse 3
D-51377 Leverkusen (DE)
Erfinder: Findeisen, Kurt, Prof. Dr.
Dünfelder Strasse 28

(54) Substituierte 1-Aryltriazolinone.

(57) Die Erfindung betrifft neue substituierte 1-Aryltriazolinone der allgemeinen Formel (I)



EP 0 617 026 A1

in welcher

R¹ für Wasserstoff, Alkyl, Halogenalkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl oder Cycloalkyl steht,

R² für einen Rest der Formel -NR⁸R⁹ steht,

R³, R⁶ und R⁷ unabhängig voneinander jeweils für Wasserstoff, Halogen, Amino oder Nitro stehen,

R⁴ für Wasserstoff, Halogen, Cyano, Nitro oder für einen der Reste -R¹⁰, -O-R¹⁰, -S-R¹⁰, -S-(O)-R¹⁰, -SO₂-R¹⁰, -SO₂-OR¹⁰, -SO₂-NR¹¹R¹², -CO-OR¹⁰, -CO-NR¹¹R¹², -O-SO₂-R¹⁰, -N-

(R¹¹)-SO₂-R¹², -NR¹¹R¹², -NH-P(O)(R¹¹)(OR¹²) oder -NH-P(O)(OR¹¹)(OR¹²) steht.
R⁵ für Nitro, Cyano, Halogen oder Halogenalkyl steht und
X für Sauerstoff oder Schwefel steht, wobei
R⁸ für Wasserstoff, Alkyl, Halogenalkyl, für einen Rest der Formel -CO-R¹² oder für eine Rest
der Formel -S(O)_n-R¹² steht,
R⁹ für Alkyl, Halogenalkyl, für einen Rest der Formel -CO-R¹² oder für einen Rest der Formel
-S(O)_n-R¹² steht,
R¹⁰ für Wasserstoff oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkinyl, Cyclo-
alkyl, Aryl, Arylalkyl oder Heterocyclyl steht,
R¹¹ für Wasserstoff oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkinyl, Cyclo-
alkyl, Arylalkyl oder Aryl steht,
R¹² für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Cycloalkyl, Arylalkyl, Aryl oder Heterocyclyl
steht und
n für eine Zahl 0, 1 oder 2 steht,
mehrere Verfahren zu ihrer Herstellung, mehrere neue Zwischenprodukte und ihre Verwendung als Herbizide.

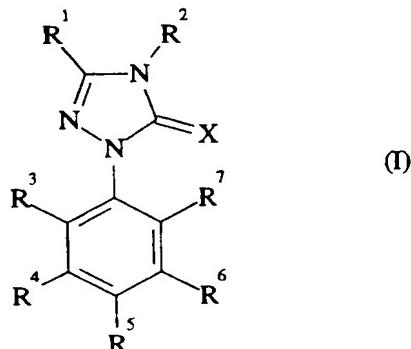
Die Erfindung betrifft neue substituierte 1-Aryltriazolinone, mehrere Verfahren zu ihrer Herstellung, mehrere neue Zwischenprodukte und ihre Verwendung als Herbizide.

Es ist bekannt, daß bestimmte substituierte Triazolinone wie beispielsweise die Verbindung 3-Methyl-4-propargyl-1-(2,5-difluor-4-cyano-phenyl)-1,2,4-triazolin-5-on herbizide Eigenschaften besitzen (vergl. z.B. DE 5 38 39 480).

Die herbizide Wirksamkeit dieser vorbekannten Verbindungen gegenüber Problemunkräutern ist jedoch ebenso wie ihre Verträglichkeit gegenüber wichtigen Kulturpflanzen nicht in allen Anwendungsgebieten völlig zufriedenstellend.

Es wurden neue substituierte 1-Aryltriazolinone der allgemeinen Formel (I),

10



15

20

25 in welcher

R¹ für Wasserstoff, Alkyl, Halogenalkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl oder Cycloalkyl steht,

R² für einen Rest der Formel -NR⁸R⁹ steht,

R³, R⁶ und R⁷ unabhängig voneinander jeweils für Wasserstoff, Halogen, Amino oder Nitro stehen,

R⁴ für Wasserstoff, Halogen, Cyano, Nitro oder für einen der Reste -R¹⁰, -O-R¹⁰, -S-R¹⁰, -S(O)-R¹⁰, -SO₂-R¹⁰, -SO₂-OR¹⁰, -SO₂-NR¹¹R¹⁰, -CO-OR¹⁰, -CO-NR¹¹R¹⁰, -O-SO₂-R¹⁰, -N(R¹¹)-SO₂-R¹⁰, -NR¹¹R¹⁰, -NH-P(O)(R¹¹)(OR¹⁰) oder -NH-P(O)(OR¹¹)(OR¹⁰) steht,

R⁵ für Nitro, Cyano, Halogen oder Halogenalkyl steht und

X für Sauerstoff oder Schwefel steht, wobei

R⁸ für Wasserstoff, Alkyl, Halogenalkyl, für einen Rest der Formel -CO-R¹² oder für eine Rest der Formel -S(O)_n-R¹² steht,

R⁹ für Alkyl, Halogenalkyl, für einen Rest der Formel -CO-R¹² oder für einen Rest der Formel -S(O)_n-R¹² steht,

R¹⁰ für Wasserstoff oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkinyl, Cycloalkyl, Aryl, Arylalkyl oder Heterocyclyl steht,

R¹¹ für Wasserstoff oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkinyl, Cycloalkyl, Arylalkyl oder Aryl steht,

R¹² für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Cycloalkyl, Arylalkyl, Aryl oder Heterocyclyl steht und

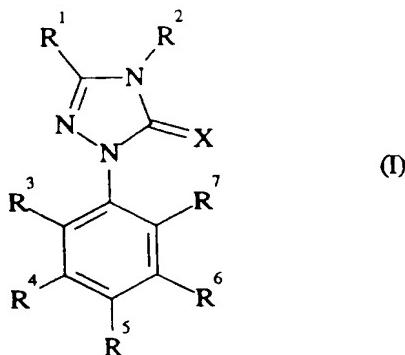
45 n für eine Zahl 0, 1 oder 2 steht,

gefunden.

Die Verbindungen der Formel (I) können gegebenenfalls in Abhängigkeit von der Art der Substituenten als geometrische und/oder optische Isomere oder Isomerengemische unterschiedlicher Zusammensetzung vorliegen. Sowohl die reinen Isomeren als auch die Isomerengemische werden erfindungsgemäß beansprucht.

Weiterhin wurde gefunden, daß man die neuen substituierten 1-Aryltriazolinone der allgemeinen Formel (I),

55



- 15 in welcher
- R¹ für Wasserstoff, Alkyl, Halogenalkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl oder Cycloalkyl steht,
- R² für einen Rest der Formel -NR⁸R⁹ steht,
- R³, R⁶ und R⁷ unabhängig voreinander jeweils für Wasserstoff, Halogen, Amino oder Nitro stehen,
- 20 R⁴ für Wasserstoff, Halogen, Cyano, Nitro oder für einen der Reste -R¹⁰, -O-R¹⁰, -S-R¹⁰, -S(O)-R¹⁰, -SO₂-R¹⁰, -SO₂-OR¹⁰, -SO₂-NR¹¹R¹⁰, -CO-OR¹⁰, -CO-NR¹¹R¹⁰, -O-SO₂-R¹⁰, -N(R¹¹)-SO₂-R¹⁰, -NR¹¹R¹⁰, -NH-P(O)(R¹¹)(OR¹⁰) oder -NH-P(O)(OR¹¹)(OR¹⁰) steht,
- R⁵ für Nitro, Cyano, Halogen oder Halogenalkyl steht und
- X für Sauerstoff oder Schwefel steht, wobei
- 25 R⁸ für Wasserstoff, Alkyl, Halogenalkyl, für einen Rest der Formel -CO-R¹² oder für eine Rest der Formel -S(O)_n-R¹² steht,
- R⁹ für Alkyl, Halogenalkyl, für einen Rest der Formel -CO-R¹² oder für einen Rest der Formel -S(O)_n-R¹² steht,
- 30 R¹⁰ für Wasserstoff oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkinyl, Cycloalkyl, Aryl, Arylalkyl oder Heterocyclyl steht,
- R¹¹ für Wasserstoff oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkinyl, Cycloalkyl, Arylalkyl oder Aryl steht,
- R¹² für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Cycloalkyl, Aryl, Arylalkyl oder Heterocyclyl steht und
- 35 n für eine Zahl 0, 1 oder 2 steht,
- erhält, wenn man
- a) 1H-Triazolinone der Formel (II),

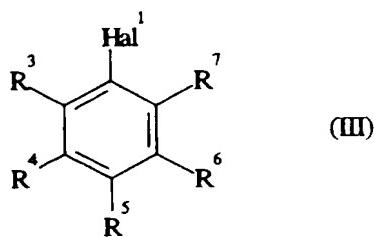


- in welcher
- R¹, R² und X die oben angegebene Bedeutung haben,
- mit Halogenbenzol-Derivaten der Formel (III),

50

55

5



10

in welcher

R^3 , R^4 , R^5 , R^6 und R^7 die oben angegebenen Bedeutungen haben und
Hal¹ für Halogen steht,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Reak-

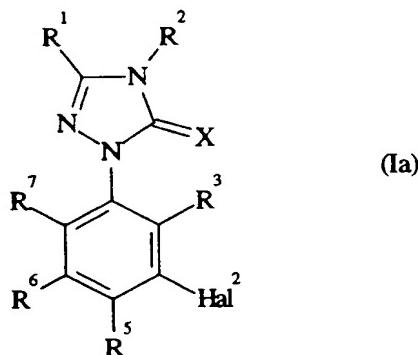
tionshilfsmittels umsetzt, oder wenn man

b) substituierte 1-Aryltriazolinone der Formel (Ia),

20

25

30



in welcher

R^1 , R^2 , R^3 , R^6 , R^5 , R^7 und X die oben angegebenen Bedeutungen haben und
Hal² für Halogen steht,

35 mit Nukleophilen der Formel (IV),

 $H-R^{13}$ (IV)

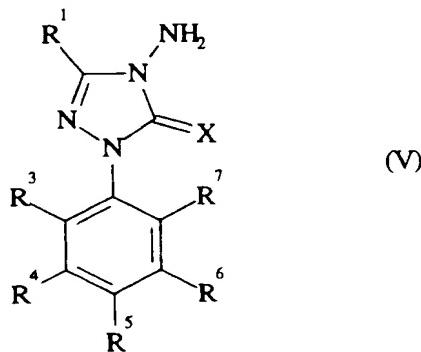
in welcher

40 R^{13} für einen Rest der Formel $-O-R^{10}$, $-S-R^{10}$ oder $-NR^{11}R^{10}$ steht, wobei
 R^{10} und R^{11} die oben angegebenen Bedeutungen haben,
gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Reak-
tionshilfsmittels umsetzt, oder wenn man
c) substituierte Triazolinone der Formel (V),

45

50

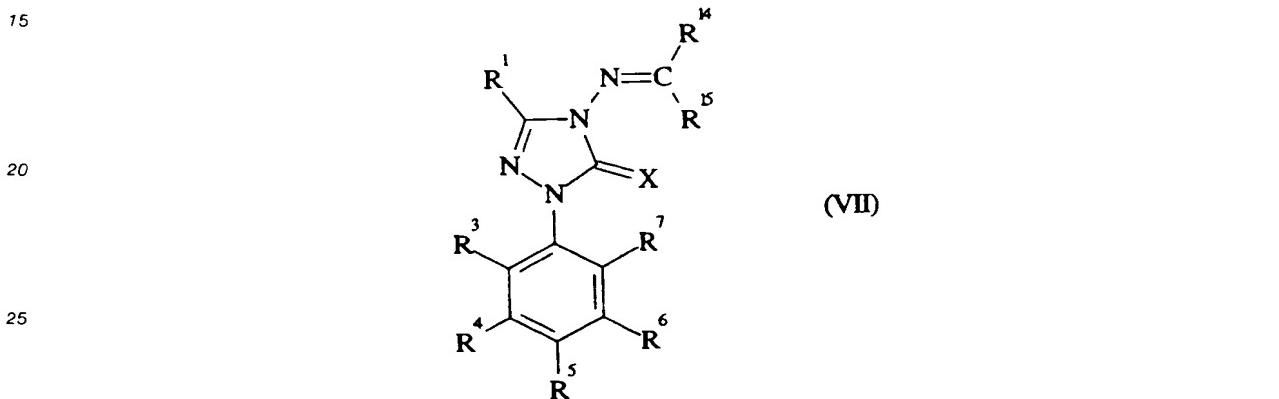
55



in welcher
 R¹, R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷ und X die oben angegebenen Bedeutungen haben,
 mit Alkylierungs-, Acylierungs- oder Sulfonylierungsmitteln der Formel (VI),

5 R⁸-E (VI)

in welcher
 R⁸ die oben angegebene Bedeutung hat und
 E für eine elektronenanziehende Abgangsgruppe steht,
 10 gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Reaktionshilfsmittels umsetzt, oder wenn man
 d) 4-Alkylidenimino-triazolinone der Formel (VII),



30 in welcher
 R¹, R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷ und X die oben angegebenen Bedeutungen haben,
 R¹⁴ für Wasserstoff oder Alkyl steht und
 R¹⁵ für Alkyl oder Alkoxy steht,
 mit einem Reduktionsmittel gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in
 35 Gegenwart eines Reaktionshilfsmittels umsetzt.

Schließlich wurde gefunden, daß die neuen substituierten 1-Aryltriazolinone der allgemeinen Formel (I) herbizide Eigenschaften besitzen.

Überraschenderweise zeigen die erfindungsgemäßen substituierten 1-Aryltriazolinone der allgemeinen Formel (I) eine erheblich bessere herbizide Wirksamkeit gegenüber Problemunkräutern bei vergleichbarer 40 Verträglichkeit gegenüber Nutzpflanzen im Vergleich zu den aus dem Stand der Technik bekannten substituierten Triazolinonen, wie beispielsweise die Verbindung 3-Methyl-4-propargyl-1-(2,5-difluor-4-cyanophenyl)-1,2,4-triazolin-5-on, welche chemisch und wirkungsmäßig naheliegende Verbindungen sind.
 Die erfindungsgemäßen substituierten 1-Aryltriazolinone sind durch die Formel (I) allgemein definiert. Bevorzugt sind Verbindungen der Formel (I), bei welchen

45 R¹ für Wasserstoff oder für jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio oder Alkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 8 Kohlenstoffatomen steht, außerdem für geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl mit 1 bis 8 Kohlenstoffatomen und 1 bis 17 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen steht oder für Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen steht,

50 R² für einen Rest der Formel -NR⁸R⁵ steht,
 R³, R⁶ und R⁷ unabhängig voneinander jeweils für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Amino oder Nitro stehen,

55 R⁴ für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Cyano, Nitro, oder für einen der Reste -R¹⁰, -O-R¹⁰, -S-R¹⁰, -S(O)-R¹⁰, -SO₂-R¹⁰, -SO₂-OR¹⁰, -SO₂-NR¹¹R¹⁰, -CO-OR¹⁰, -CO-NR¹¹R¹⁰, -O-SO₂-R¹⁰, -N(R¹¹)-SO₂-R¹⁰, -NR¹¹R¹⁰, -NH-P(O)(R¹¹)(OR¹⁰) oder -NH-P(O)-(OR¹¹)(OR¹⁰) steht,

R⁵ für Nitro, Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Iod oder für geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 13 gleichen oder verschiedenen

Halogenatomen steht und
 X für Sauerstoff oder Schwefel steht, wobei
 R⁸ für Wasserstoff, für geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit 1 bis 8 Kohlenstoffatomen oder für geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl mit 1 bis 8 Kohlenstoffatomen und 1 bis 17 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen steht und außerdem für einen Rest der Formel -CO-R¹² oder für einen Rest der Formel -S(O)_n-R¹² steht,
 5 R⁹ für geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit 1 bis 8 Kohlenstoffatomen oder für geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl mit 1 bis 8 Kohlenstoffatomen und 1 bis 17 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen steht und außerdem für einen Rest der Formel -CO-R¹² oder für einen Rest der Formel -S(O)_n-R¹² steht,
 10 R¹⁰ für Wasserstoff steht;
 R¹⁰ außerdem für gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden substituiertes, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit 1 bis 14 Kohlenstoffatomen steht, wobei als Substituenten infrage kommen:
 15 Halogen - insbesondere Fluor, Chlor, Brom und/oder Iod -, Cyano, Carboxyl, Carbamoyl, jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy, Alkoxyalkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl, Alkoxy carbonyl, N-Alkylaminocarbonyl, N,N-Dialkylaminocarbonyl oder Alkylsulfonylaminocarbonyl mit jeweils 1 bis 8 Kohlenstoffatomen in den einzelnen Alkylteilen oder Heterocyclyl, wobei als Heterocyclrest ein fünf- bis siebengliedriger, gegebenenfalls benzannellierter, gesättigter oder ungesättigter Heterocyclus mit 1 bis 3 gleichen oder verschiedenen Heteroatomen - insbesondere Stickstoff, Sauerstoff und/oder Schwefel - steht;
 20 R¹⁰ außerdem für jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen - insbesondere Fluor, Chlor, Brom und/oder Iod - substituiertes Alkenyl oder Alkinyl mit jeweils 2 bis 8 Kohlenstoffatomen steht;
 25 R¹⁰ außerdem für gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen - insbesondere Fluor, Chlor, Brom und/oder Iod - und/oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen substituiertes Cycloalkyl mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen steht;
 30 R¹⁰ außerdem für jeweils gegebenenfalls im Arylteil einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden substituiertes Arylalkyl oder Aryl mit jeweils 6 bis 10 Kohlenstoffatomen im Arylteil und gegebenenfalls 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im geradkettigen oder verzweigten Alkylteil steht, oder für einen gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden substituierten und/oder benzannellierten, gesättigten oder ungesättigten, fünf- bis siebengliedrigen Heterocyclrest mit 1 bis 3 gleichen oder verschiedenen Heteroatomen - insbesondere Stickstoff, Sauerstoff und/oder Schwefel - steht, wobei als Aryl- bzw. Heterocyclsubstituenten jeweils infrage kommen:
 35 Halogen, Cyano, Nitro, Amino, N-Acetyl amino, jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl oder Alkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen, jeweils geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Halogenalkylthio, Halogenalkylsulfinyl oder Halogenalkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 13 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen, jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy carbonyl oder Alkoxyiminoalkyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den einzelnen Alkylteilen sowie gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen und/oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl oder Alkoxy mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen und/oder geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl oder Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 13 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen substituiertes Phenyl;
 40 R¹¹ für Wasserstoff steht;
 R¹¹ außerdem für gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden substituiertes, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit 1 bis 14 Kohlenstoffatomen steht, wobei als Substituenten infrage kommen:
 45 Halogen - insbesondere Fluor, Chlor, Brom und/oder Iod -, Cyano, Carboxyl, Carbamoyl, jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy, Alkoxyalkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl, Alkoxy carbonyl, N-Alkylaminocarbonyl, N,N-Dialkylaminocarbonyl oder Alkylsulfonylaminocarbonyl mit jeweils 1 bis 8 Kohlenstoffatomen in den einzelnen Alkylteilen oder Heterocyclyl, wobei als Heterocyclrest ein fünf- bis siebengliedriger, gegebenenfalls benzannellierter, gesättigter oder ungesättigter Heterocyclus mit 1 bis 3 gleichen oder verschiedenen Heteroatomen - insbesondere Stickstoff, Sauerstoff und/oder Schwefel - steht;
 50 Halogen - insbesondere Fluor, Chlor, Brom und/oder Iod -, Cyano, Carboxyl, Carbamoyl, jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy, Alkoxyalkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl, Alkoxy carbonyl, N-Alkylaminocarbonyl, N,N-Dialkylaminocarbonyl oder Alkylsulfonylaminocarbonyl mit jeweils 1 bis 8 Kohlenstoffatomen in den einzelnen Alkylteilen oder Heterocyclyl, wobei als Heterocyclrest ein fünf- bis siebengliedriger, gegebenenfalls benzannellierter, gesättigter oder ungesättigter Heterocyclus mit 1 bis 3 gleichen oder verschiedenen Heteroatomen - insbesondere Stickstoff, Sauerstoff und/oder Schwefel - steht;

riger, gegebenenfalls benzannellierter, gesättigter oder ungesättigter Heterocyclus mit 1 bis 3 gleichen oder verschiedenen Heteroatomen - insbesondere Stickstoff, Sauerstoff und/oder Schwefel steht;

5 R¹¹ außerdem für jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen - insbesondere Fluor, Chlor, Brom und/oder Iod - substituiertes Alkenyl oder Alkinyl mit jeweils 2 bis 8 Kohlenstoffatomen steht;

10 R¹¹ außerdem für gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen - insbesondere Fluor, Chlor, Brom und/oder Iod - und/oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen substituiertes Cycloalkyl mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen steht;

15 R¹¹ außerdem für jeweils gegebenenfalls im Arylteil einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden substituiertes Arylalkyl oder Aryl mit jeweils 6 bis 10 Kohlenstoffatomen im Arylteil und gegebenenfalls 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im geradkettigen oder verzweigten Alkylteil steht, wobei als Arylsubstituenten jeweils infrage kommen:

20 Halogen, Cyano, Nitro, Amino, N-Acetylarnino, jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl oder Alkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen, jeweils geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Halogenalkylthio, Halogenalkylsulfinyl oder Halogenalkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 13 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen, jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy carbonyl oder Alkoximinoalkyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den einzelnen Alkylteilen sowie gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen und/oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl oder Alkoxy mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen und/oder geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl oder Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 13 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen substituiertes Phenyl;

25 R¹² für gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden substituiertes, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit 1 bis 8 Kohlenstoffatomen steht, wobei als Substituenten infrage kommen:

30 Halogen - insbesondere Fluor, Chlor, Brom und/oder Iod -, Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen oder Heterocycl, wobei als Heterocyclrest ein fünf- bis sieben-gliedriger, gegebenenfalls benzannellierter, gesättigter oder ungesättigter Heterocyclus mit 1 bis 3 gleichen oder verschiedenen Heteroatomen - insbesondere Stickstoff, Sauerstoff und/oder Schwefel - steht;

35 R¹² außerdem für gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen - insbesondere Fluor, Chlor, Brom und/oder Iod - und/oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen substituiertes Cycloalkyl mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen steht;

40 R¹² außerdem für jeweils gegebenenfalls im Arylteil einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden substituiertes Arylalkyl oder Aryl mit jeweils 6 bis 10 Kohlenstoffatomen im Arylteil und gegebenenfalls 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im geradkettigen oder verzweigten Alkylteil steht oder für einen gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden substituierten und/oder benzannellierten, gesättigten oder ungesättigten, fünf- bis siebengliedrigen Heterocyclrest mit 1 bis 3 gleichen oder verschiedenen Heteroatomen - insbesondere Stickstoff, Sauerstoff und/oder Schwefel - steht, wobei als Aryl- bzw. Heterocyclsubstituenten jeweils infrage kommen:

45 Halogen, Cyano, Nitro, Amino, N-Acetylarnino, jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl oder Alkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen, jeweils geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Halogenalkylthio, Halogenalkylsulfinyl oder Halogenalkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 13 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen, jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy carbonyl oder Alkoximinoalkyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den einzelnen Alkylteilen sowie gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen und/oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl oder Alkoxy mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen und/oder geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl oder Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 13 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen substituiertes Phenyl und

| | |
|--|--|
| n | für eine Zahl 0, 1 oder 2 steht. |
| | Besonders bevorzugt sind Verbindungen der Formel (I), bei welchen |
| R ¹ | für Wasserstoff oder für jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio oder Alkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen steht, außerdem für geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 13 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen - insbesondere Fluor, Chlor oder Brom - steht oder für Cycloalkyl mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen steht, |
| 5 R ² | für einen Rest der Formel -NR ⁸ R ⁹ steht, |
| R ³ , R ⁶ und R ⁷ | unabhängig voneinander jeweils für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Amino oder Nitro stehen, |
| 10 R ⁴ | für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Nitro, oder für einen der Reste -R ¹⁰ , -O-R ¹⁰ , -S-R ¹⁰ , -S(O)-R ¹⁰ , -SO ₂ -R ¹⁰ , -SO ₂ -OR ¹⁰ , -SO ₂ -NR ¹¹ R ¹⁰ , -CO-OR ¹⁰ , -CO-NR ¹¹ R ¹⁰ , -O-SO ₂ -R ¹⁰ , -N(R ¹¹)-SO ₂ -R ¹⁰ , -NR ¹¹ R ¹⁰ , -NH-P(O)(R ¹¹)(OR ¹⁰) oder -NH-P(O)(OR ¹¹)-(OR ¹⁰) steht, |
| 15 R ⁵ | für Nitro, Cyano, Fluor, Chlor, Brom oder für geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 9 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen - insbesondere Fluor, Chlor oder Brom - steht und |
| X | für Sauerstoff oder Schwefel steht, wobei |
| 20 R ⁸ | für Wasserstoff, für geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen oder für geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 13 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen - insbesondere Fluor, Chlor oder Brom - steht und außerdem für einen Rest der Formel -CO-R ¹² oder für einen Rest der Formel -S(O) _n -R ¹² steht, |
| 25 R ⁹ | für geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen oder für geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 13 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen - insbesondere Fluor, Chlor oder Brom - steht und außerdem für einen Rest der Formel -CO-R ¹² oder für einen Rest der Formel -S(O) _n -R ¹² steht, |
| 30 R ¹⁰ | für Wasserstoff steht; |
| R ¹⁰ | außerdem für gegebenenfalls einfach oder zweifach, gleich oder verschieden substituiertes, geradkettiges oder verzweigtes <u>Alkyl</u> mit 1 bis 12 Kohlenstoffatomen steht, wobei als Substituenten infrage kommen: |
| 35 | Cyano, Carboxyl, Carbamoyl, jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy, Alkoxyalkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl, Alkoxycarbonyl, N-Alkylaminocarbonyl, N,N-Dialkylaminocarbonyl oder Alkylsulfonylaminocarbonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den einzelnen Alkylteilen oder Heterocyclyl, wobei als Heterocyclylrest ein fünf- bis siebengliedriger, gegebenenfalls benzannellierter, gesättigter oder ungesättigter Heterocyclus mit 1 bis 3 gleichen oder verschiedenen Heteroatomen - insbesondere Stickstoff, Sauerstoff und/oder Schwefel - steht; |
| 40 R ¹⁰ | außerdem für geradkettiges oder verzweigtes <u>Halogenalkyl</u> mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 13 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen - insbesondere Fluor, Chlor und oder Brom - steht, |
| R ¹⁰ | außerdem für jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach, gleich oder verschieden durch Halogen - insbesondere Fluor, Chlor und/oder Brom - substituiertes <u>Alkenyl</u> oder <u>Alkinyl</u> mit jeweils 2 bis 6 Kohlenstoffatomen steht; |
| 45 R ¹⁰ | außerdem für gegebenenfalls einfach bis dreifach, gleich oder verschieden durch Halogen - insbesondere Fluor, Chlor und/oder Brom - und/oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit 1 bis 3 Kohlenstoffatomen substituiertes <u>Cycloalkyl</u> mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen steht; |
| 50 R ¹⁰ | außerdem für jeweils gegebenenfalls im Phenylteil einfach bis fünffach, gleich oder verschieden substituiertes Phenylalkyl oder Phenyl mit gegebenenfalls 1 bis 3 Kohlenstoffatomen im geradkettigen oder verzweigten Alkylteil steht, oder für einen gegebenenfalls einfach bis dreifach, gleich oder verschieden substituierten und/oder benzannellierten, gesättigten oder ungesättigten, fünf- bis siebengliedrigen <u>Heterocyclylrest</u> mit 1 bis 3 gleichen oder verschiedenen Heteroatomen - insbesondere Stickstoff, Sauerstoff und/oder Schwefel - steht, wobei als Phenyl- bzw. Heterocyclylsubstituenten jeweils infrage kommen: |
| 55 | Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Nitro, Amino, N-Acetylarnino, jeweils geradkettiges oder |

verzweigtes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl oder Alkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, jeweils geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Halogenalkylthio, Halogenalkylsulfinyl oder Halogenalkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 9 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen, jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy carbonyl oder Alkoximinoalkyl mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen in den einzelnen Alkyteilen sowie gegebenenfalls einfach bis fünffach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom und/oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl oder Alkoxy mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und/oder geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl oder Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 9 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen substituiertes Phenyl;

5 R¹¹ für Wasserstoff steht;

10 R¹¹ außerdem für gegebenenfalls einfach oder zweifach, gleich oder verschieden substituiertes, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit 1 bis 12 Kohlenstoffatomen steht, wobei als Substituenten infrage kommen:

15 Cyano, Carboxyl, Carbamoyl, jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy, Alkoxyalkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl, Alkoxy carbonyl, N-Alkylaminocarbonyl, N,N-Dialkylaminocarbonyl oder Alkylsulfonylaminocarbonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den einzelnen Alkyteilen oder Heterocyclyl, wobei als Heterocyclrest ein fünf- bis siebengliedriger, gegebenenfalls benzannellierter, gesättigter oder ungesättigter Heterocyclus mit 1 bis 3 gleichen oder verschiedenen Heteroatomen - insbesondere Stickstoff, Sauerstoff und/oder Schwefel - steht;

20 R¹¹ außerdem für geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 13 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen - insbesondere Fluor, Chlor und/oder Brom - steht,

25 R¹¹ außerdem für jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach, gleich oder verschieden durch Halogen - insbesondere Fluor, Chlor und/oder Brom - substituiertes Alkenyl oder Alkinyl mit jeweils 2 bis 6 Kohlenstoffatomen steht;

30 R¹¹ außerdem für gegebenenfalls einfach bis dreifach, gleich oder verschieden durch Halogen - insbesondere Fluor, Chlor und/oder Brom - und/oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit 1 bis 3 Kohlenstoffatomen substituiertes Cycloalkyl mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen steht;

35 R¹¹ außerdem für jeweils gegebenenfalls im Phenylteil einfach bis fünffach, gleich oder verschieden substituiertes Phenylalkyl oder Phenyl mit gegebenenfalls 1 bis 3 Kohlenstoffatomen im geradkettigen oder verzweigten Alkyteil steht, wobei als Phenylsubstituenten jeweils infrage kommen:

Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Nitro, Amino, N-Acetylarnino, jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl oder Alkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, jeweils geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Halogenalkylthio, Halogenalkylsulfinyl oder Halogenalkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 9 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen, jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy carbonyl oder Alkoximinoalkyl mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen in den einzelnen Alkyteilen sowie gegebenenfalls einfach bis fünffach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom und/oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl oder Alkoxy mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und/oder geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl oder Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 9 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen substituiertes Phenyl;

40 R¹² für gegebenenfalls einfach oder zweifach, gleich oder verschieden substituiertes, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit 1 bis 12 Kohlenstoffatomen steht, wobei als Substituenten infrage kommen:

Cycloalkyl mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen oder Heterocyclyl, wobei als Heterocyclrest ein fünf- bis siebengliedriger, gegebenenfalls benzannellierter, gesättigter oder ungesättigter Heterocyclus mit 1 bis 3 gleichen oder verschiedenen Heteroatomen - insbesondere Stickstoff, Sauerstoff und/oder Schwefel - steht;

45 R¹² außerdem für geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 13 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen - insbesondere Fluor, Chlor und/oder Brom - steht,

R¹² außerdem für gegebenenfalls einfach bis dreifach, gleich oder verschieden durch Halogen - insbesondere Fluor, Chlor und/oder Brom - und/oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit 1 bis 3 Kohlenstoffatomen substituiertes Cycloalkyl mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen steht;

5 R¹² außerdem für jeweils gegebenenfalls im Phenylteil einfach bis fünffach, gleich oder verschieden substituiertes Phenylalkyl oder Phenyl mit gegebenenfalls 1 bis 3 Kohlenstoffatomen im geradkettigen oder verzweigten Alkylteil steht, oder für einen gegebenenfalls einfach bis dreifach, gleich oder verschieden substituierten und/oder benzanellierten, gesättigten oder ungesättigten, fünf- bis siebengliedrigen Heterocyclrest mit 1 bis 3 gleichen oder verschiedenen Heteroatomen - insbesondere Stickstoff, Sauerstoff und/oder Schwefel - steht, wobei als Phenyl- bzw. Heterocyclsubstituenten jeweils infrage kommen:

10 Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Nitro, Amino, N-Acetylarnino, jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl oder Alkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, jeweils geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Halogenalkylthio, Halogenalkylsulfinyl oder Halogenalkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 9 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen, jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy carbonyl oder Alkoximinoalkyl mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen in den einzelnen Alkylteilen sowie gegebenenfalls einfach bis fünffach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom und/oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl oder Alkoxy mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und/oder geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl oder Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 9 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen substituiertes Phenyl und

15 n für eine Zahl 0, 1 oder 2 steht.

Ganz besonders bevorzugt sind Verbindungen der Formel (I), bei welchen

R¹ für Wasserstoff oder für jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio oder Alkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen steht, außerdem für geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 9 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen - insbesondere Fluor, Chlor oder Brom - steht, oder für Cycloalkyl mit 3, 5 oder 6 Kohlenstoffatomen steht,

30 R² für einen Rest der Formel -NR⁸R⁹ steht,

R³, R⁶ und R⁷ unabhängig voneinander jeweils für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Amino oder Nitro stehen,

35 R⁴ für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Nitro, oder für einen der Reste -R¹⁰, -O-R¹⁰, -S(O)-R¹⁰, -SO₂-R¹⁰, -SO₂-OR¹⁰, -SO₂-NR¹¹R¹⁰, -CO-OR¹⁰, -CO-NR¹¹R¹⁰, -O-SO₂-R¹⁰, -N(R¹¹)-SO₂-R¹⁰, -NR¹¹R¹⁰, -NH-P(O)(R¹¹)(OR¹⁰) oder -NH-P(O)(OR¹¹)-(OR¹⁰) steht,

40 R⁵ für Nitro, Cyano, Fluor, Chlor, Brom oder für geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl mit 1 bis 3 Kohlenstoffatomen und 1 bis 7 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen steht und

X für Sauerstoff oder Schwefel steht, wobei

45 R⁸ für Wasserstoff, für geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen oder für geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 9 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen - insbesondere Fluor, Chlor oder Brom - steht und außerdem für einen Rest der Formel -CO-R¹² oder für einen Rest der Formel -S(O)_n-R¹² steht,

50 R⁹ für geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen oder für geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 9 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen - insbesondere Fluor, Chlor oder Brom - steht und außerdem für einen Rest der Formel -CO-R¹² oder für einen Rest der Formel -S(O)_n-R¹² steht,

55 R¹⁰ für Wasserstoff steht;

R¹⁰ außerdem für gegebenenfalls einfach substituiertes, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit 1 bis 8 Kohlenstoffatomen steht, wobei als Substituenten infrage kommen: Cyano, Carboxyl, Carbamoyl, jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy, Alkoxyalkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl, Alkoxy carbonyl, N-Alkylaminocarbonyl, N,N-Dialkylaminocarbonyl oder Alkylsulfonylaminocarbonyl mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoff-

atomen in den einzelnen Alkylteilen oder Heterocyclyl, wobei als Heterocyclylrest ein fünf- oder sechsgliedriger, gegebenenfalls benzannellierter, gesättigter oder aromatischer Heterocyclus mit 1 bis 3 gleichen oder verschiedenen Heteroatomen - insbesondere Stickstoff, Sauerstoff und/oder Schwefel - steht;

5 R^c
 außerdem für geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 9 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen - insbesondere Fluor, Chlor und/oder Brom - steht,

10 R^c
 außerdem für jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach, gleich oder verschieden durch Halogen - insbesondere Fluor, Chlor und/oder Brom - substituiertes Alkenyl oder Alkinyl mit jeweils 2 bis 6 Kohlenstoffatomen steht;

15 R^c
 außerdem für gegebenenfalls einfach bis dreifach, gleich oder verschieden durch Halogen - insbesondere Fluor, Chlor und/oder Brom - und/oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit 1 bis 3 Kohlenstoffatomen substituiertes Cycloalkyl mit 3, 5 oder 6 Kohlenstoffatomen steht;

20 R^c
 außerdem für jeweils gegebenenfalls im Phenylteil einfach bis dreifach, gleich oder verschieden substituiertes Phenylalkyl oder Phenyl mit gegebenenfalls 1 bis 3 Kohlenstoffatomen im geradkettigen oder verzweigten Alkylteil steht oder für einen gegebenenfalls einfach bis dreifach, gleich oder verschieden substituierten und/oder benzannellierten, gesättigten oder aromatischen, fünf- oder sechsgliedrigen Heterocyclylrest mit 1 bis 3 gleichen oder verschiedenen Heteroatomen - insbesondere Stickstoff, Sauerstoff und/oder Schwefel - steht, wobei als Phenyl- bzw. Heterocyclylsubstituenten jeweils infrage kommen:

25 R^c
 Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Nitro, Amino, N-Acetylamino, jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl oder Alkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 3 Kohlenstoffatomen, jeweils geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Halogenalkylthio, Halogenalkylsulfinyl oder Halogenalkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 3 Kohlenstoffatomen und 1 bis 7 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen, jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy carbonyl oder Alkoximinoalkyl mit jeweils 1 bis 3 Kohlenstoffatomen in den einzelnen Alkylteilen sowie gegebenenfalls einfach bis dreifach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom und/oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl oder Alkoxy mit jeweils 1 bis 3 Kohlenstoffatomen und/oder geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl oder Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 3 Kohlenstoffatomen und 1 bis 7 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen substituiertes Phenyl;

30 R^c
 für Wasserstoff steht;

35 R¹¹
 außerdem für gegebenenfalls einfach substituiertes, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit 1 bis 8 Kohlenstoffatomen steht, wobei als Substituenten infrage kommen: Cyano, Carboxyl, Carbamoyl, jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy, Alkoxyalkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl, Alkoxy carbonyl, N-Alkylaminocarbonyl, N,N-Dialkylaminocarbonyl oder Alkylsulfonylaminocarbonyl mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen in den einzelnen Alkylteilen oder Heterocyclyl, wobei als Heterocyclylrest ein fünf- oder sechsgliedriger, gegebenenfalls benzannellierter, gesättigter oder aromatischer Heterocyclus mit 1 bis 3 gleichen oder verschiedenen Heteroatomen - insbesondere Stickstoff, Sauerstoff und/oder Schwefel - steht;

40 R¹¹
 außerdem für geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 9 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen - insbesondere Fluor, Chlor und/oder Brom - steht,

45 R¹¹
 außerdem für jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach, gleich oder verschieden durch Halogen - insbesondere Fluor, Chlor und/oder Brom - substituiertes Alkenyl oder Alkinyl mit jeweils 2 bis 6 Kohlenstoffatomen steht;

50 R¹¹
 außerdem für gegebenenfalls einfach bis dreifach, gleich oder verschieden durch Halogen - insbesondere Fluor, Chlor und/oder Brom - und/oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit 1 bis 3 Kohlenstoffatomen substituiertes Cycloalkyl mit 3, 5 oder 6 Kohlenstoffatomen steht;

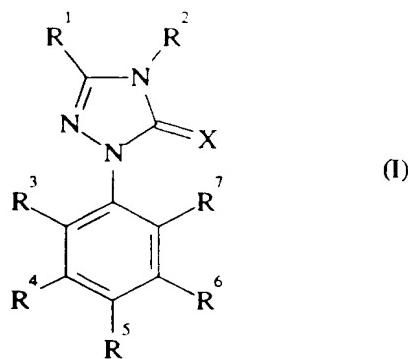
55 R¹¹
 außerdem für jeweils gegebenenfalls im Phenylteil einfach bis dreifach, gleich oder verschieden substituiertes Phenylalkyl oder Phenyl mit gegebenenfalls 1 bis 3 Kohlenstoffatomen im geradkettigen oder verzweigten Alkylteil steht, wobei als Phenylsubstituenten jeweils infrage kommen:

| | |
|----|---|
| | Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Nitro, Amino, N-Acetylarnino, jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl oder Alkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 3 Kohlenstoffatomen, jeweils geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Halogenalkylthio, Halogenalkylsulfinyl oder Halogenalkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 3 Kohlenstoffatomen und 1 bis 7 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen, jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkoxycarbonyl oder Alkoximinoalkyl mit jeweils 1 bis 3 Kohlenstoffatomen in den einzelnen Alkylteilen sowie gegebenenfalls einfach bis dreifach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom und/oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl oder Alkoxy mit jeweils 1 bis 3 Kohlenstoffatomen und/oder geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl oder Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 3 Kohlenstoffatomen und 1 bis 7 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen substituiertes Phenyl; |
| 5 | R ¹² für gegebenenfalls einfach substituiertes, geradkettiges oder verzweigtes <u>Alkyl</u> mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen steht, wobei als Substituenten infrage kommen: |
| 10 | Cycloalkyl mit 3, 5 oder 6 Kohlenstoffatomen oder Heterocyclyl, wobei als Heterocyclrest ein fünf- oder sechsgliedriger, gegebenenfalls benzannellierter, gesättigter oder aromatischer Heterocyclus mit 1 bis 3 gleichen oder verschiedenen Heteroatomen - insbesondere Stickstoff, Sauerstoff und/oder Schwefel - steht; |
| 15 | R ¹² außerdem für geradkettiges oder verzweigtes <u>Halogenalkyl</u> mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 9 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen - insbesondere Fluor, Chlor und/oder Brom - steht, |
| 20 | R ¹² außerdem für gegebenenfalls einfach bis dreifach, gleich oder verschieden durch Halogen - insbesondere Fluor, Chlor und/oder Brom - und/oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit 1 bis 3 Kohlenstoffatomen substituiertes <u>Cycloalkyl</u> mit 3, 5 oder 6 Kohlenstoffatomen steht; |
| 25 | R ¹² außerdem für jeweils gegebenenfalls im Phenylteil einfach bis dreifach, gleich oder verschieden substituiertes <u>Phenylalkyl</u> oder <u>Phenyl</u> mit gegebenenfalls 1 bis 3 Kohlenstoffatomen im geradkettigen oder verzweigten Alkylteil steht, oder für einen gegebenenfalls einfach bis dreifach, gleich oder verschieden substituierten und/oder benzannellierten, gesättigten oder aromatischen, fünf- oder sechsgliedrigen <u>Heterocyclrest</u> mit 1 bis 3 gleichen oder verschiedenen Heteroatomen - insbesondere Stickstoff, Sauerstoff und/oder Schwefel - steht, wobei als Phenyl- bzw. Heterocyclsubstuenten jeweils infrage kommen: |
| 30 | Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Nitro, Amino, N-Acetylarnino, jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl oder Alkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 3 Kohlenstoffatomen, jeweils geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Halogenalkylthio, Halogenalkylsulfinyl oder Halogenalkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 3 Kohlenstoffatomen und 1 bis 7 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen, jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkoxycarbonyl oder Alkoximinoalkyl mit jeweils 1 bis 3 Kohlenstoffatomen in den einzelnen Alkylteilen sowie gegebenenfalls einfach bis dreifach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom und/oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl oder Alkoxy mit jeweils 1 bis 3 Kohlenstoffatomen und/oder geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl oder Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 3 Kohlenstoffatomen und 1 bis 7 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen substituiertes Phenyl und |
| 35 | n für eine Zahl 0, 1 oder 2 steht. |

Im einzelnen seien außer den bei den Herstellungsbeispielen aufgeführten Verbindungen die folgenden substituierten Triazolinone der allgemeinen Formel (I) genannt:

50

55



| | R<sup>1</sup> | R<sup>2</sup> | R<sup>3</sup> | R<sup>4</sup> | R<sup>5</sup> | R<sup>6</sup> | R<sup>7</sup> | X |
|----|----------------------------------|----------------------------------|----------------------------------|---|----------------------------------|----------------------------------|----------------------------------|----------|
| 20 | CH₃ | -NH-CH₃ | H | OH | CN | H | F | O |
| | CH₃ | -NH-CH₃ | H | OH | CN | H | Cl | O |
| | CH₃ | -NH-CH₃ | H | OH | NO₂ | H | F | O |
| | CH₃ | -NH-CH₃ | H | OH | NO₂ | H | Cl | O |
| 25 | CH₃ | -NH-CH₃ | H | OH | CF₃ | H | Cl | O |
| | CH₃ | -NH-CH₃ | Cl | OH | NO₂ | H | Cl | O |
| | CH₃ | -NH-CH₃ | NO₂ | OH | CF₃ | H | NO₂ | O |
| 30 | CH₃ | -NH-CH₃ | H | -O-CH₃ | CN | H | F | O |
| | CH₃ | -NH-CH₃ | H | -O-CH₃ | CF₃ | Cl | H | O |
| | CH₃ | -NH-CH₃ | H | -O-CH₃ | NO₂ | H | F | O |
| | CH₃ | -NH-CH₃ | H | Cl | CN | H | H | O |
| 35 | CH₃ | -NH-CH₃ | H | -O-CH(CH₃)-COOC₂H₅ | CN | H | Cl | O |
| | CH₃ | -NH-CH₃ | H | -O-CH₂-CN | CN | H | F | O |
| | CH₃ | -NH-CH₃ | H | -O-Cyclopentyl | CN | H | Cl | O |
| 40 | CH₃ | -NH-CH₃ | H | -O-Cyclopentyl | NO₂ | H | F | O |

45

50

55

| | R¹ | R² | R³ | R⁴ | R⁵ | R⁶ | R⁷ | X |
|----|----------------------|----------------------|----------------------|---|----------------------|----------------------|----------------------|----------|
| 5 | CH ₃ | -NH-CH ₃ | H | -O-CH ₂ -C(Cl)=CH ₂ | CN | H | H | O |
| | CH ₃ | -NH-CH ₃ | H | -O-CH ₂ -C(Cl)=CH ₂ | CN | H | Cl | O |
| | CH ₃ | -NH-CH ₃ | F | F | CF ₃ | H | H | O |
| | CH ₃ | -NH-CH ₃ | H | -O-SO ₂ -CH ₃ | CN | H | F | O |
| 10 | CH ₃ | -NH-CH ₃ | H | -O-SO ₂ -CH ₃ | CN | H | Cl | O |
| | CH ₃ | -NH-CH ₃ | H | -O-SO ₂ -CH ₃ | NO ₂ | H | Cl | O |
| | CH ₃ | -NH-CH ₃ | H | F | CN | H | H | O |
| 15 | CH ₃ | -NH-CH ₃ | H | -O-CHF ₂ | CN | H | F | O |
| | CH ₃ | -NH-CH ₃ | H | -O-CHF ₂ | CN | H | Cl | O |
| | CH ₃ | -NH-CH ₃ | H | -O-CHF ₂ | NO ₂ | H | F | O |
| | CH ₃ | -NH-CH ₃ | H | -O-CHF ₂ | CF ₃ | H | F | O |
| 20 | CH ₃ | -NH-CH ₃ | H | -O-CHF ₂ | NO ₂ | H | Cl | O |
| | CH ₃ | -NH-CH ₃ | H | -SCH ₃ | NO ₂ | H | Cl | O |
| | CH ₃ | -NH-CH ₃ | H | -SCH ₃ | NO ₂ | H | F | O |
| 25 | CH ₃ | -NH-CH ₃ | H | -SCH ₃ | CN | H | F | O |
| | CH ₃ | -NH-CH ₃ | H | -SCH ₃ | CN | H | H | O |
| | CH ₃ | -NH-CH ₃ | H | -SCH ₃ | CF ₃ | H | Cl | O |
| 30 | CH ₃ | -NH-CH ₃ | Cl | -SCH ₃ | CF ₃ | H | Cl | O |
| | CH ₃ | -NH-CH ₃ | H | -NH-CH ₃ | CN | H | Cl | O |
| | CH ₃ | -NH-CH ₃ | H | -NH-CH ₃ | CN | H | F | O |
| | CH ₃ | -NH-CH ₃ | H | -NH-CH ₃ | CN | H | H | O |
| 35 | CH ₃ | -NH-CH ₃ | H | -NH-CH ₃ | NO ₂ | H | F | O |
| | CH ₃ | -NH-CH ₃ | Cl | -NH-CH ₃ | CF ₃ | H | Cl | O |
| | CH ₃ | -NH-CH ₃ | Cl | -N(CH ₃) ₂ | CF ₃ | H | Cl | O |
| 40 | CH ₃ | -NH-CH ₃ | H | -N(CH ₃) ₂ | CN | H | Cl | O |
| | CH ₃ | -NH-CH ₃ | H | -N(CH ₃) ₂ | CN | H | F | O |
| | CH ₃ | -NH-CH ₃ | H | -N(CH ₃) ₂ | NO ₂ | H | Cl | O |

45

50

55

| | R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | R ⁵ | R ⁶ | R ⁷ | X |
|----|-----------------|---------------------|----------------|--|-----------------|----------------|----------------|---|
| 5 | CH ₃ | -NH-CH ₃ | H | -NH-CH ₂ -CH=CH ₂ | NO ₂ | H | F | O |
| | CH ₃ | -NH-CH ₃ | H | -NH-CH ₂ -CH=CH ₂ | CN | H | Cl | O |
| | CH ₃ | -NH-CH ₃ | H | -NH-SO ₂ -CH ₃ | NO ₂ | H | Cl | O |
| | CH ₃ | -NH-CH ₃ | H | -N(CH ₃)-SO ₂ -CH ₃ | NO ₂ | H | Cl | O |
| 10 | CH ₃ | -NH-CH ₃ | H | -COOC ₂ H ₅ | CN | H | F | O |
| | CH ₃ | -NH-CH ₃ | H | -COOCH ₃ | CN | H | Cl | O |
| | CH ₃ | -NH-CH ₃ | H | -CO-NH-CH ₃ | CN | H | Cl | O |
| | CH ₃ | -NH-CH ₃ | H | -CO-N(CH ₃) ₂ | CN | H | F | O |
| 15 | CH ₃ | -NH-CH ₃ | H | -S(O)-CH ₃ | CN | H | F | O |
| | CH ₃ | -NH-CH ₃ | H | -SO ₂ -CH ₃ | NO ₂ | H | F | O |
| | CH ₃ | -NH-CH ₃ | H | -SO ₂ -NH-CH ₃ | NO ₂ | H | Cl | O |
| | CH ₃ | -NH-CH ₃ | H | -SO ₂ -NH-CH ₃ | CN | H | F | O |
| 20 | CH ₃ | -NH-CH ₃ | H | -SO ₂ -O-CH ₃ | CN | H | F | O |
| | CH ₃ | -NH-CH ₃ | H | $\begin{matrix} \text{O} \\ \parallel \\ \text{--NH--P--OCH}_3 \\ \\ \text{CH}_3 \end{matrix}$ | CN | H | F | O |
| | CH ₃ | -NH-CH ₃ | H | $\begin{matrix} \text{O} \\ \parallel \\ \text{--NH--P--OCH}_3 \\ \\ \text{CH}_3 \end{matrix}$ | CN | H | F | O |
| | 25 | | | | | | | |

30

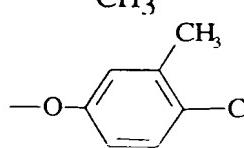
35

40

45

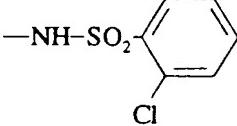
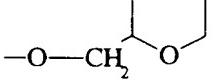
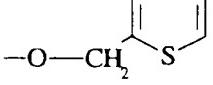
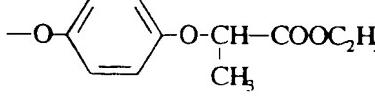
50

55

| | R¹ | R² | R³ | R⁴ | R⁵ | R⁶ | R⁷ | X |
|----|---------------------------------|-----------------------------------|----------------------|---|----------------------|----------------------|----------------------|----------|
| 5 | CH ₃ | -NH-CH ₃ | H | O -NH-P(OC ₂ H ₅) ₂ | CN | H | Cl | O |
| | C ₂ H ₅ | -NH-CH ₃ | Cl | H | CN | H | Cl | O |
| | C ₂ H ₅ | -NH-CH ₃ | NO ₂ | H | CF ₃ | H | NO ₂ | O |
| 10 | C ₂ H ₅ | -NH-CH ₃ | H | CH ₃ | NO ₂ | H | H | O |
| | C ₂ H ₅ | -NH-CH ₃ | H | C ₂ H ₅ | NO ₂ | H | H | O |
| | C ₂ H ₅ | -NH-CH ₃ | Cl | F | CF ₃ | H | Cl | O |
| 15 | C ₂ H ₅ | -NH-CH ₃ | H | Cl | CN | Cl | H | O |
| | C ₂ H ₅ | -NH-CH ₃ | H | -OCH ₃ | CN | H | F | O |
| | C ₂ H ₅ | -NH-C ₂ H ₅ | H | -OCH ₃ | CN | H | F | O |
| | C ₂ H ₅ | -NH-C ₂ H ₅ | Cl | F | CF ₃ | H | Cl | O |
| 20 | C ₂ H ₅ | -NH-C ₂ H ₅ | H | -NH-SO ₂ -CH ₃ | CN | H | F | O |
| | C ₂ H ₅ | -NH-C ₂ H ₅ | H | -O-CH(CH ₃)-C≡CH | CN | H | F | O |
| | C ₂ H ₅ | -NH-C ₂ H ₅ | H | -S-C ₂ H ₅ | CN | H | F | O |
| 25 | n-C ₃ H ₇ | -NH-CH ₃ | NO ₂ | H | CF ₃ | H | NO ₂ | O |
| | n-C ₃ H ₇ | -NH-CH ₃ | H | OH | CN | H | Cl | O |
| | n-C ₃ H ₇ | -NH-CH ₃ | H | -OCH ₃ | CN | H | F | O |
| 30 | n-C ₃ H ₇ | -NH-CH ₃ | H | -NH-SO ₂ -CH ₃ | CN | H | Cl | O |
| | n-C ₃ H ₇ | -NH-CH ₃ | H | -O-CH(CH ₃)-C≡CH | CN | H | F | O |
| | n-C ₃ H ₇ | -NH-CH ₃ | H | -S-CH(CH ₃)-COOCH ₃ | CN | H | F | O |
| | n-C ₃ H ₇ | -NH-CH ₃ | H | -O-CH ₂ -COOCH ₃ | CN | H | F | O |
| 35 | n-C ₃ H ₇ | -NH-CH ₃ | H | CH ₃ | NO ₂ | H | H | O |
| | i-C ₃ H ₇ | -NH-CH ₃ | H | CH ₃ | NO ₂ | H | H | O |
| | i-C ₃ H ₇ | -NH-CH ₃ | H |  | CN | H | F | O |
| 40 | i-C ₃ H ₇ | -NH-CH ₃ | H | H | NO ₂ | H | H | O |
| | i-C ₃ H ₇ | -NH-CH ₃ | H | -COOC ₂ H ₅ | CN | H | F | O |
| 45 | i-C ₃ H ₇ | -NH-CH ₃ | H | -CO-NH-CH ₃ | CN | H | Cl | O |

50

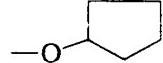
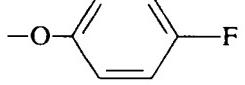
55

| | R¹ | R² | R³ | R⁴ | R⁵ | R⁶ | R⁷ | X |
|----|---------------------------------|-----------------------------------|----------------------|---|----------------------|----------------------|----------------------|----------|
| 5 | i-C ₃ H ₇ | -NH-CH ₃ | H | -S-C ₂ H ₅ | CN | H | F | O |
| | i-C ₃ H ₇ | -NH-CH ₃ | H | -S-(CH ₂) ₂ -OC ₂ H ₅ | CN | H | F | O |
| | △ | -NH-CH ₃ | NO ₂ | H | CF ₃ | H | NO ₂ | O |
| 10 | △ | -NH-CH ₃ | H | OH | CN | H | F | O |
| | △ | -NH-CH ₃ | H | -OCH ₃ | CN | H | F | O |
| 15 | △ | -NH-CH ₃ | H | -CO-NH-CH ₃ | CN | H | F | O |
| 20 | △ | -NH-CH ₃ | H | -O-SO ₂ -CH ₃ | CN | H | F | O |
| | △ | -NH-CH ₃ | H | -SO ₂ -O-CH ₃ | CN | H | F | O |
| 25 | △ | -NH-CH ₃ | H | -NH-SO ₂ -  | CN | H | F | O |
| 30 | △ | -NH-CH ₃ | H | -O-  | CN | H | F | O |
| | △ | -NH-CH ₃ | H | -O-  | CN | H | F | O |
| 35 | △ | -NH-CH ₃ | H | -O-  | CN | H | F | O |
| 40 | △ | -NH-CH ₃ | H | -O-  | CN | H | F | O |
| | △ | -N(CH ₃) ₂ | NO ₂ | H | CF ₃ | H | NO ₂ | O |
| 45 | | | | | | | | |
| 50 | | | | | | | | |
| 55 | | | | | | | | |

| | R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | R ⁵ | R ⁶ | R ⁷ | X |
|----|-----------------|-----------------------------------|----------------|---|-----------------|----------------|----------------|---|
| 5 | ▷ | -N(CH ₃) ₂ | Cl | H | CF ₃ | H | H | O |
| 10 | ▷ | -N(CH ₃) ₂ | H | OH | CN | H | Cl | O |
| 15 | ▷ | -NH-CH ₃ | H | -OCH ₃ | CN | H | F | O |
| 20 | ▷ | -NH-CH ₃ | H | -S-C ₂ H ₅ | CN | H | F | O |
| 25 | ▷ | -NH-CH ₃ | H | -N(CH ₃) ₂ | CN | H | F | O |
| 30 | ▷ | -NH-CH ₃ | H | -O-CH(CH ₃)-COO-C ₂ H ₅ | CN | H | F | O |
| 35 | ▷ | -N(CH ₃) ₂ | H | —NH—P(OC ₂ H ₅) ₂ O | CN | H | F | O |
| 40 | CH ₃ | -N(CH ₃) ₂ | H | —NH—P(OCH ₃) O CH ₃ | CN | H | F | O |
| 45 | CH ₃ | -N(CH ₃) ₂ | H | OH | CN | H | F | O |
| | CH ₃ | -N(CH ₃) ₂ | H | OH | CN | H | Cl | O |
| | CH ₃ | -N(CH ₃) ₂ | H | OH | NO ₂ | H | Cl | O |
| | CH ₃ | -N(CH ₃) ₂ | H | OH | NO ₂ | H | F | O |
| | CH ₃ | -N(CH ₃) ₂ | H | -NH ₂ | CN | H | F | O |
| | CH ₃ | -N(CH ₃) ₂ | H | -NH ₂ | CN | H | Cl | O |
| | CH ₃ | -N(CH ₃) ₂ | H | -OCH ₃ | CN | H | F | O |
| | CH ₃ | -N(CH ₃) ₂ | H | -OCH ₃ | CN | H | F | S |

50

55

| | R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | R ⁵ | R ⁶ | R ⁷ | X |
|----|-------------------------------|-----------------------------------|----------------|---|-----------------|----------------|----------------|---|
| 5 | CH ₃ | -N(CH ₃) ₂ | H | -S-CH ₃ | CN | H | F | O |
| | CH ₃ | -N(CH ₃) ₂ | H | -S-CH ₃ | CN | H | F | S |
| | CH ₃ | -N(CH ₃) ₂ | H | -CO-NH-CH ₃ | CN | H | F | O |
| 10 | CH ₃ | -N(CH ₃) ₂ | H | -CO-N(CH ₃) ₂ | CN | H | Cl | O |
| | CH ₃ | -N(CH ₃) ₂ | H | -NH-SO ₂ -CH ₃ | CN | H | Cl | S |
| | CH ₃ | -N(CH ₃) ₂ | H | -NH-SO ₂ -C ₂ H ₅ | CN | H | F | S |
| | CH ₃ | -N(CH ₃) ₂ | H | -OCHF ₂ | CN | H | F | O |
| 15 | CH ₃ | -N(CH ₃) ₂ | H | -OCHF ₂ | CN | H | F | O |
| | CH ₃ | -N(CH ₃) ₂ | H | -N(CH ₃) ₂ | CN | H | F | O |
| | CH ₃ | -N(CH ₃) ₂ | H | -NH-C ₂ H ₅ | CN | H | F | O |
| 20 | CH ₃ | -N(CH ₃) ₂ | H | -O-CH ₂ -C(Cl)=CH ₂ | CN | H | F | O |
| | CH ₃ | -N(CH ₃) ₂ | H | -O-SO ₂ -CH ₃ | CN | H | F | O |
| | CH ₃ | -N(CH ₃) ₂ | H | -SO ₂ -O-CH ₃ | CN | H | Cl | O |
| 25 | CH ₃ | -N(CH ₃) ₂ | H |  | CN | H | F | O |
| | CH ₃ | -N(CH ₃) ₂ | H | -O-CH ₂ -C ₆ H ₅ | CN | H | F | O |
| 30 | CH ₃ | -N(CH ₃) ₂ | H |  | CN | H | F | O |
| | CH ₃ | -N(CH ₃) ₂ | H |  | CN | H | F | O |
| 35 | CH ₃ | -N(CH ₃) ₂ | H | -O-CH(CH ₃)-COOCH ₃ | CN | H | F | O |
| | CH ₃ | -N(CH ₃) ₂ | H | -O-CH(CH ₃)-COOCH ₃ | NO ₂ | H | F | O |
| | CH ₃ | -N(CH ₃) ₂ | Cl | -O-CH(CH ₃)-COOCH ₃ | CF ₃ | H | Cl | O |
| 40 | CH ₃ | -N(CH ₃) ₂ | Cl | -O-CH(CH ₃)-C≡CH | CF ₃ | H | Cl | O |
| | CH ₃ | -N(CH ₃) ₂ | H | -O-CH(CH ₃)-C≡CH | NO ₂ | H | F | O |
| | C ₂ H ₅ | -N(CH ₃) ₂ | H | -O-CH(CH ₃)-C≡CH | NO ₂ | H | F | O |
| 45 | C ₂ H ₅ | -N(CH ₃) ₂ | H | -O-CH ₂ -C≡CH | NO ₂ | H | F | O |

50

55

| | R¹ | R² | R³ | R⁴ | R⁵ | R⁶ | R⁷ | X |
|----|---------------------------------|-----------------------------------|----------------------|---|----------------------|----------------------|----------------------|----------|
| 5 | C ₂ H ₅ | -N(CH ₃) ₂ | H | -O-CH ₂ -C ₆ H ₅ | CN | H | F | O |
| | C ₂ H ₅ | -N(CH ₃) ₂ | H | -N(CH ₃) ₂ | CN | H | F | O |
| | C ₂ H ₅ | -N(CH ₃) ₂ | H | -N(CH ₃) ₂ | NO ₂ | H | F | O |
| | C ₂ H ₅ | -N(CH ₃) ₂ | H | -OCH ₃ | NO ₂ | H | F | O |
| 10 | C ₂ H ₅ | -N(CH ₃) ₂ | H | -OCH ₃ | CN | H | Cl | O |
| | C ₂ H ₅ | -N(CH ₃) ₂ | H | OH | CN | H | Cl | O |
| | CH ₃ | -N(CH ₃) ₂ | H | SH | CN | H | F | O |
| | CH ₃ | -N(CH ₃) ₂ | H | SH | CN | H | F | O |
| 15 | i-C ₃ H ₇ | -N(CH ₃) ₂ | H | SH | CN | H | F | O |
| | i-C ₃ H ₇ | -N(CH ₃) ₂ | H | OH | CN | H | F | O |
| | i-C ₃ H ₇ | -N(CH ₃) ₂ | H | OCH ₃ | CN | H | F | O |
| | i-C ₃ H ₇ | -N(CH ₃) ₂ | NO ₂ | H | CF ₃ | H | NO ₂ | O |
| 20 | i-C ₃ H ₇ | -N(CH ₃) ₂ | Cl | H | CN | H | Cl | O |
| | i-C ₃ H ₇ | -N(CH ₃) ₂ | H | Cl | CN | Cl | H | O |
| | i-C ₃ H ₇ | -N(CH ₃) ₂ | H | -S-CH(CH ₃)-COOCH ₃ | CN | H | F | O |
| | i-C ₃ H ₇ | -N(CH ₃) ₂ | H | -O-CH ₂ -CN | CN | H | F | O |
| 25 | i-C ₃ H ₇ | -N(CH ₃) ₂ | H | -O-C(Cl)=CH ₂ | CN | H | F | O |
| | i-C ₃ H ₇ | -N(CH ₃) ₂ | H | -COOCH ₃ | CN | H | F | O |
| | i-C ₃ H ₇ | -N(CH ₃) ₂ | H | -N(CH ₃)-SO ₂ -CH ₃ | CN | H | F | O |
| | i-C ₃ H ₇ | -N(CH ₃) ₂ | H | -N(CH ₃)-SO ₂ -C ₂ H ₅ | CN | H | F | O |
| 30 | i-C ₃ H ₇ | -N(CH ₃) ₂ | H | -CO-NH-CH ₃ | CN | H | F | O |
| | i-C ₃ H ₇ | -N(CH ₃) ₂ | H | -N(C ₂ H ₅)-SO ₂ -CH ₃ | CN | H | Cl | O |
| | CH ₃ | -N(CH ₃) ₂ | H | -NH-SO ₂ -CH ₃ | CN | H | F | O |
| | CH ₃ | -N(CH ₃) ₂ | H | -O-CH(CH ₃)-C≡CH | CN | H | F | O |
| 35 | CH ₃ | -N(CH ₃) ₂ | H | -O-CH ₂ -CH=CH ₂ | CN | H | F | O |
| | CH ₃ | -N(CH ₃) ₂ | H | -O-CH ₂ -C≡CH | CN | H | F | O |
| | CH ₃ | -N(CH ₃) ₂ | H | -NH-SO ₂ -C ₂ H ₅ | CN | H | F | O |
| | CH ₃ | -N(CH ₃) ₂ | Cl | -NH-SO ₂ -CH ₃ | NO ₂ | H | Cl | O |
| 45 | | | | | | | | |
| 50 | | | | | | | | |
| 55 | | | | | | | | |

| | R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | R ⁵ | R ⁶ | R ⁷ | X |
|----|--------------------|-----------------------------------|-----------------|---|-----------------|----------------|-----------------|---|
| 5 | CH ₃ | -N(CH ₃) ₂ | H | -NH ₂ | CN | H | F | O |
| | CH ₃ | -N(CH ₃) ₂ | H | OH | CN | H | F | O |
| | CH ₃ | -N(CH ₃) ₂ | H | SH | CN | H | F | O |
| 10 | CH ₃ | -N(CH ₃) ₂ | H | SH | CN | H | F | O |
| | CH ₃ | -N(CH ₃) ₂ | H | -OCH ₃ | CN | H | F | O |
| | CH ₃ | -N(CH ₃) ₂ | H | -O-CH(CH ₃)-C≡CH | CN | H | F | O |
| 15 | CH ₃ | -N(CH ₃) ₂ | H | -O-CH ₂ -CH=CH ₂ | CN | H | F | O |
| | CH ₃ | -N(CH ₃) ₂ | H | -O-CH ₂ -C≡CH | CN | H | Cl | O |
| | CH ₃ | -N(CH ₃) ₂ | H | -NH-SO ₂ -C ₂ H ₅ | CN | H | F | O |
| 20 | CH ₃ | -N(CH ₃) ₂ | H | -NH-SO ₂ -CH ₃ | CN | H | F | O |
| | CF ₃ | -NH-CH ₃ | H | F | CN | H | Cl | S |
| | CF ₃ | -NH-CH ₃ | H | OH | CN | H | F | O |
| 25 | CF ₃ | -NH-CH ₃ | H | OH | NO ₂ | H | F | O |
| | CF ₃ | -NH-CH ₃ | H | -OCH ₃ | CN | H | F | O |
| | CF ₃ | -NH-CH ₃ | H | -OCH ₃ | NO ₂ | H | F | O |
| 30 | CF ₃ | -NH-CH ₃ | H | -OCH ₃ | CN | H | F | O |
| | CF ₃ | -NH-CH ₃ | H | -O-CH ₂ -CN | CN | H | F | O |
| | CF ₃ | -NH-CH ₃ | H | -COOCH ₃ | CN | H | F | O |
| 35 | CF ₃ | -NH-CH ₃ | H | -COOCH ₃ | CN | H | Cl | O |
| | CF ₃ | -NH-CH ₃ | H | -N(CH ₃)-SO ₂ -C ₂ H ₅ | CN | H | Cl | O |
| | CF ₃ | -NH-CH ₃ | NO ₂ | H | CF ₃ | H | NO ₂ | O |
| 40 | CF ₃ | -NH-CH ₃ | H | Cl | CN | Cl | H | O |
| | CF ₃ | -NH-CH ₃ | H | -O-CH ₂ -CH=CH ₂ | CN | H | F | O |
| | CF ₃ | -NH-CH ₃ | H | -NH-CH ₂ -CH=CH ₂ | CN | H | F | O |
| 45 | F ₂ CH- | -NH-CH ₃ | H | F | CN | H | Cl | O |
| | F ₂ CH- | -NH-CH ₃ | H | OH | CN | H | F | O |
| | F ₂ CH- | -NH-CH ₃ | H | -O-CH ₂ -CH=CH ₂ | CN | H | F | O |
| 50 | F ₂ CH- | -NH-CH ₃ | H | -O-CH ₂ -CH=CH ₂ | CN | H | F | S |

45

50

55

| | R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | R ⁵ | R ⁶ | R ⁷ | X |
|----|---------------------|-----------------------------------|----------------|---|-----------------|----------------|----------------|---|
| 5 | F ₂ CH- | -NH-CH ₃ | H | -NH-SO ₂ -n-C ₄ H ₉ | CN | H | F | O |
| | F ₂ CH- | -NH-CH ₃ | H | -S-C ₂ H ₅ | CN | H | F | O |
| | F ₂ CH- | -N(CH ₃) ₂ | H | -S-C ₂ H ₅ | CN | H | F | O |
| 10 | F ₂ CH- | -N(CH ₃) ₂ | H | -NH-SO ₂ -C ₂ H ₅ | CN | H | Cl | O |
| | F ₂ CH- | -N(CH ₃) ₂ | H | CH ₃ | NO ₂ | H | H | O |
| | F ₂ CH- | -N(CH ₃) ₂ | H | -O-CH ₂ -C≡CH | NO ₂ | H | F | O |
| | F ₂ CH- | -N(CH ₃) ₂ | H | -COOC ₂ H ₅ | CN | H | F | O |
| 15 | F ₂ CH- | -N(CH ₃) ₂ | H | -S-CH(CH ₃)-COOCH ₃ | CN | H | F | O |
| | CF ₃ | -N(CH ₃) ₂ | H | -NH-SO ₂ -CH ₃ | NO ₂ | H | Cl | O |
| | CF ₃ | -N(CH ₃) ₂ | H | -O-SO ₂ -CH ₃ | CN | H | F | O |
| | CF ₃ | -N(CH ₃) ₂ | H | -SO ₂ -CH ₃ | CN | H | F | O |
| 20 | CF ₃ | -N(CH ₃) ₂ | H | -NH-CH(CH ₃) ₂ | CN | H | Cl | O |
| | CF ₃ | -N(CH ₃) ₂ | H | -O-CH ₂ -C≡CH | CN | H | F | O |
| | CF ₃ | -N(CH ₃) ₂ | H | -COOC ₂ H ₅ | CN | H | F | O |
| 25 | CF ₃ | -N(CH ₃) ₂ | H | -CO-NH-CH ₃ | CN | H | F | O |
| | CF ₃ | -N(CH ₃) ₂ | H | -O-SO ₂ -CH ₃ | CN | H | Cl | O |
| | CH ₃ -S- | -N(CH ₃) ₂ | H | -CH ₃ | NO ₂ | H | H | O |
| 30 | CH ₃ -S- | -N(CH ₃) ₂ | H | OH | CN | H | F | O |
| | CH ₃ -S- | -N(CH ₃) ₂ | H | OH | CN | H | Cl | O |
| | CH ₃ -S- | -N(CH ₃) ₂ | H | -S-C ₂ H ₅ | CN | H | F | O |
| | CH ₃ -S- | -N(CH ₃) ₂ | H | -O-CH ₂ -C≡CH | NO ₂ | H | F | O |
| 35 | CH ₃ -S- | -N(CH ₃) ₂ | H | -COOCH ₃ | CN | H | F | O |
| | CH ₃ -S- | -N(CH ₃) ₂ | H | -NH-CH(CH ₃) ₂ | CN | H | F | O |
| | CH ₃ -S- | -N(CH ₃) ₂ | H | -N(CH ₃)-SO ₂ -CH ₃ | CN | H | F | O |
| 40 | CH ₃ -S- | -NH-CH ₃ | H | -S-C ₂ H ₅ | CN | H | F | O |
| | CH ₃ -S- | -NH-CH ₃ | H | -NH-CH ₂ -CH=CH ₂ | CN | H | F | O |
| | CH ₃ -S- | -NH-CH ₃ | H | -O-CH ₂ -CN | CN | H | F | O |
| 45 | CH ₃ -S- | -NH-CH ₃ | H | -O-SO ₂ -CH ₃ | CN | H | F | O |

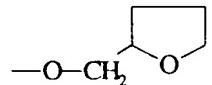
50

55

| | R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | R ⁵ | R ⁶ | R ⁷ | X | |
|----|------------------------------------|------------------------------------|-----------------------------------|---|------------------|-----------------|----------------|---|---|
| 5 | CH ₃ -S- | -NH-CH ₃ | H | -O-CH(CH ₃)-COOCH ₃ | CN | H | F | O | |
| | CH ₃ -S- | -NH-CH ₃ | H | -O-CH ₂ -C ₆ H ₅ | CN | H | F | O | |
| | CH ₃ -S- | -NH-CH ₃ | H | -O-CH ₂ -C ₆ H ₅ | NO ₂ | H | F | O | |
| | CH ₃ -S- | -NH-CH ₃ | H | -COOCH ₃ | CN | H | Cl | O | |
| 10 | CH ₃ -S- | -NH-CH ₃ | H | | CN | H | F | O | |
| | | | | | | | | | |
| 15 | CH ₃ -S(O)- | -N(CH ₃) ₂ | H | -CH ₃ | NO ₂ | H | H | O | |
| | CH ₃ -S(O)- | -N(CH ₃) ₂ | H | OH | CN | H | F | O | |
| | CH ₃ -S(O)- | -N(CH ₃) ₂ | H | OH | CN | H | Cl | O | |
| | CH ₃ -S(O)- | -N(CH ₃) ₂ | H | -S-C ₂ H ₅ | CN | H | F | O | |
| 20 | CH ₃ -S(O)- | -N(CH ₃) ₂ | H | -O-CH ₂ -C≡CH | NO ₂ | H | F | O | |
| | CH ₃ -S(O)- | -N(CH ₃) ₂ | H | -COOCH ₃ | CN | H | F | O | |
| | CH ₃ -S(O)- | -N(CH ₃) ₂ | H | -NH-CH(CH ₃) ₂ | CN | H | F | O | |
| | CH ₃ -S(O)- | -N(CH ₃) ₂ | H | -N(CH ₃)-SO ₂ -CH ₃ | CN | H | F | O | |
| 25 | CH ₃ -S(O)- | -NH-CH ₃ | H | -S-C ₂ H ₅ | CN | H | F | O | |
| | CH ₃ -S(O)- | -NH-CH ₃ | H | -NH-CH ₂ -CH=CH ₂ | CN | H | F | O | |
| | CH ₃ -S(O)- | -NH-CH ₃ | H | -O-CH ₂ -CN | CN | H | F | O | |
| | CH ₃ -S(O)- | -NH-CH ₃ | H | -O-SO ₂ -CH ₃ | CN | H | F | O | |
| 30 | CH ₃ -S(O)- | -NH-CH ₃ | H | -O-CH(CH ₃)-COOCH ₃ | CN | H | F | O | |
| | CH ₃ -S(O)- | -NH-CH ₃ | H | -O-CH ₂ -C ₆ H ₅ | CN | H | F | O | |
| | CH ₃ -S(O)- | -NH-CH ₃ | H | -O-CH ₂ -C ₆ H ₅ | NO ₂ | H | F | O | |
| | CH ₃ -S(O)- | -NH-CH ₃ | H | -COOCH ₃ | CN | H | Cl | O | |
| 35 | CH ₃ -S(O)- | -NH-CH ₃ | H | | CN | H | F | O | |
| | | | | | | | | | |
| | 40 | CH ₃ -SO ₂ - | -N(CH ₃) ₂ | H | -CH ₃ | NO ₂ | H | H | O |
| | | | H | OH | CN | H | F | O | |
| | | | H | OH | CN | H | Cl | O | |
| 45 | CH ₃ -SO ₂ - | -N(CH ₃) ₂ | H | | | | | | |

50

55

| | R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | R ⁵ | R ⁶ | R ⁷ | X |
|----|------------------------------------|-----------------------------------|-----------------|--|-----------------|----------------|-----------------|---|
| 5 | CH ₃ -SO ₂ - | -N(CH ₃) ₂ | H | -S-C ₂ H ₅ | CN | H | F | O |
| | CH ₃ -SO ₂ - | -N(CH ₃) ₂ | H | -O-CH ₂ -C≡CH | NO ₂ | H | F | O |
| | CH ₃ -SO ₂ - | -N(CH ₃) ₂ | H | -COOCH ₃ | CN | H | F | O |
| | CH ₃ -SO ₂ - | -N(CH ₃) ₂ | H | -NH-CH(CH ₃) ₂ | CN | H | F | O |
| 10 | CH ₃ -SO ₂ - | -N(CH ₃) ₂ | H | -N(CH ₃)-SO ₂ -CH ₃ | CN | H | F | O |
| | CH ₃ -SO ₂ - | -NH-CH ₃ | H | -S-C ₂ H ₅ | CN | H | F | O |
| | CH ₃ -SO ₂ - | -NH-CH ₃ | H | -NH-CH ₂ -CH=CH ₂ | CN | H | F | O |
| | CH ₃ -SO ₂ - | -NH-CH ₃ | H | -O-CH ₂ -CN | CN | H | F | O |
| 15 | CH ₃ -SO ₂ - | -NH-CH ₃ | H | -O-SO ₂ -CH ₃ | CN | H | F | O |
| | CH ₃ -SO ₂ - | -NH-CH ₃ | H | -O-CH(CH ₃)-COOCH ₃ | CN | H | F | O |
| | CH ₃ -SO ₂ - | -NH-CH ₃ | H | -O-CH ₂ -C ₆ H ₅ | CN | H | F | O |
| | CH ₃ -SO ₂ - | -NH-CH ₃ | H | -O-CH ₂ -C ₆ H ₅ | NO ₂ | H | F | O |
| 20 | CH ₃ -SO ₂ - | -NH-CH ₃ | H | -COOCH ₃ | CN | H | Cl | O |
| | CH ₃ -SO ₂ - | -NH-CH ₃ | H |  | CN | H | F | O |
| | CH ₃ -SO ₂ - | -NH-CH ₃ | H | | | | | |
| | CH ₃ O | -N(CH ₃) ₂ | NO ₂ | H | CF ₃ | H | NO ₂ | O |
| 25 | CH ₃ O | -N(CH ₃) ₂ | H | F | CN | H | H | O |
| | CH ₃ O | -N(CH ₃) ₂ | H | Cl | CN | Cl | H | O |
| | CH ₃ O | -N(CH ₃) ₂ | H | -OCH ₃ | CN | H | F | O |
| | CH ₃ O | -N(CH ₃) ₂ | H | -S-C ₂ H ₅ | CN | H | F | O |
| 30 | CH ₃ O | -N(CH ₃) ₂ | H | -O-CH ₂ -CH=CH ₂ | CN | H | Cl | O |
| | CH ₃ O | -N(CH ₃) ₂ | H | NH ₂ | CN | H | F | O |
| | CH ₃ O | -N(CH ₃) ₂ | H | -N(CH ₃)-SO ₂ -CH ₃ | CN | H | F | O |
| | CH ₃ O | -N(CH ₃) ₂ | H | -COOCH ₃ | CN | H | F | O |
| 35 | CH ₃ O | -N(CH ₃) ₂ | Cl | H | NO ₂ | H | Cl | O |
| | CH ₃ O | -N(CH ₃) ₂ | H | -S-CH(CH ₃)-COOCH ₃ | CN | H | Cl | O |
| | CH ₃ O | -N(CH ₃) ₂ | H | -O-CH(Cl)=CH ₂ | CN | H | F | O |
| | CH ₃ O | -NH-CH ₃ | H | OH | CN | H | F | O |
| 40 | CH ₃ O | -N(CH ₃) ₂ | | | | | | |
| | CH ₃ O | -N(CH ₃) ₂ | | | | | | |
| 45 | CH ₃ O | -N(CH ₃) ₂ | | | | | | |
| | CH ₃ O | -N(CH ₃) ₂ | | | | | | |

50

55

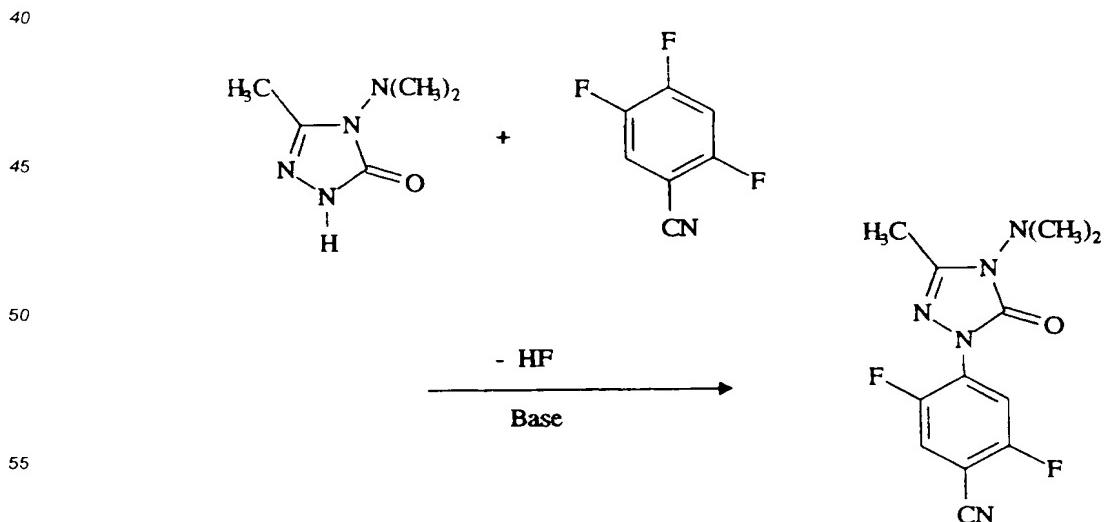
| | R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | R ⁵ | R ⁶ | R ⁷ | X |
|----|-------------------|-----------------------------------|----------------|--|-----------------|----------------|----------------|---|
| 5 | CH ₃ O | -NH-CH ₃ | H | OH | NO ₂ | H | F | O |
| | CH ₃ O | -NH-CH ₃ | H | -OCH ₃ | NO ₂ | H | F | O |
| | CH ₃ O | -NH-CH ₃ | H | -OCH ₃ | CN | H | Cl | O |
| | CH ₃ O | -NH-CH ₃ | H | -SCH ₃ | CN | H | Cl | O |
| 10 | CH ₃ O | -NH-CH ₃ | H | -O-CH(CH ₃)-C≡CH | CN | H | F | O |
| | CH ₃ O | -NH-CH ₃ | H | -O-CH(CH ₃)-C≡CH | CN | H | F | S |
| | CH ₃ O | -NH-CH ₃ | H | -O-CH ₂ -CH=CH ₂ | CN | H | F | O |
| | CH ₃ O | -NH-CH ₃ | H | -NH-CH ₂ -CH=CH ₂ | CN | H | F | O |
| 15 | CH ₃ O | -NH-CH ₃ | H | -NH-CH ₂ -CH=CH ₂ | NO ₂ | H | F | O |
| | CH ₃ O | -NH-CH ₃ | H | -NH-SO ₂ -C ₂ H ₅ | NO ₂ | H | F | O |
| | CH ₃ O | -NH-CH ₃ | H | -NH-SO ₂ -C ₂ H ₅ | CN | H | Cl | O |
| | CH ₃ O | -NH-CH ₃ | H | -NH-SO ₂ -C ₂ H ₅ | CN | H | F | O |
| 20 | CH ₃ O | -NH-CH ₃ | H | -NH-SO ₂ -C ₂ H ₅ | CN | H | F | S |
| | CH ₃ O | -NH-CH ₃ | H | -NH-SO ₂ -C ₂ H ₅ | CN | H | F | O |
| | CH ₃ | -NH-CF ₃ | H | F | CN | H | H | O |
| | CH ₃ | -NH-CF ₃ | H | -OCH ₃ | CN | H | F | O |
| 25 | CH ₃ | -NH-CF ₃ | H | -S-C ₂ H ₅ | CN | H | F | O |
| | CH ₃ | -NH-CF ₃ | H | -O-CH(CH ₃)-C≡CH | CN | H | F | O |
| | CH ₃ | -NH-CF ₃ | H | -NH-SO ₂ -C ₂ H ₅ | CN | H | F | O |
| | CH ₃ | -NH-CF ₃ | H | -NH-SO ₂ -C ₂ H ₅ | CN | H | F | O |
| 30 | CH ₃ | -NH-CF ₃ | H | -NH-SO ₂ -C ₂ H ₅ | CN | H | F | O |
| | CH ₃ | -NH-CF ₃ | H | -NH-SO ₂ -C ₂ H ₅ | CN | H | F | O |
| | CH ₃ | -NH-CF ₃ | H | -NH-SO ₂ -C ₂ H ₅ | CN | H | Cl | O |
| | CH ₃ | -NH-CF ₃ | H | -NH-SO ₂ -C ₂ H ₅ | CN | H | F | O |
| 35 | CH ₃ | -NH-CF ₃ | H | -COOCH ₃ | CN | H | F | O |
| | CH ₃ | -NH-CF ₃ | H | -NH-CH ₃ | CN | H | F | O |
| | CH ₃ | -NH-CF ₃ | H | OH | CN | H | F | O |
| | H | -N(CH ₃) ₂ | H | F | CN | H | F | O |
| 40 | H | -N(CH ₃) ₂ | H | OH | CN | H | F | O |
| | H | -N(CH ₃) ₂ | H | -O-CH(CH ₃)-C≡CH | CN | H | F | O |
| | H | -N(CH ₃) ₂ | H | -NH-SO ₂ -CH ₃ | CN | H | F | O |
| | H | -N(CH ₃) ₂ | H | | | | | |
| 45 | | | | | | | | |

50

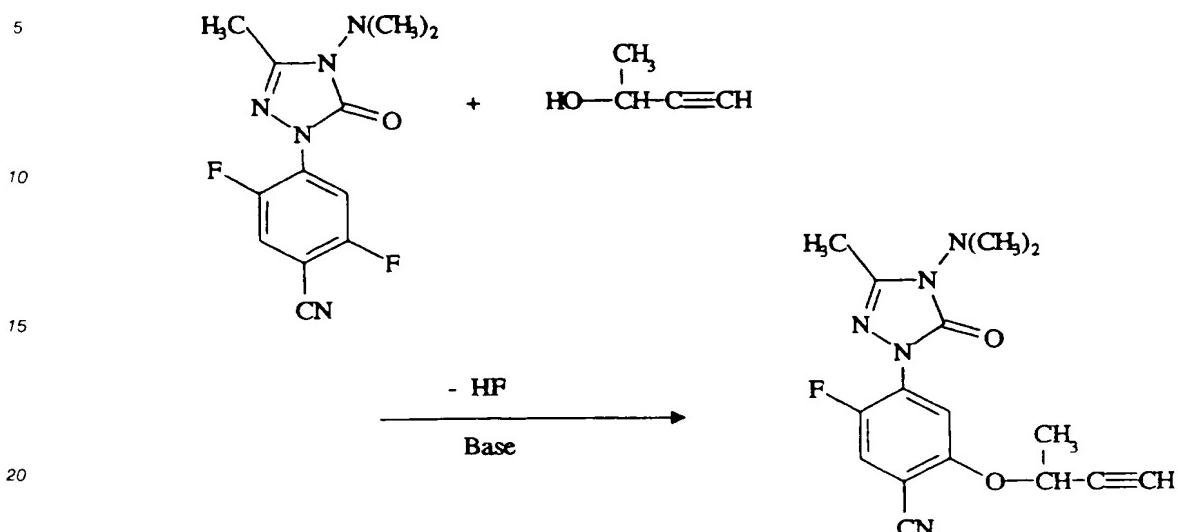
55

| | R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | R ⁵ | R ⁶ | R ⁷ | X |
|----|----------------|-----------------------------------|----------------|--|-----------------|----------------|----------------|---|
| 5 | H | -N(CH ₃) ₂ | H | -N(CH ₃) ₂ | CN | H | F | O |
| | H | -N(CH ₃) ₂ | H | -N(CH ₃)SO ₂ -C ₂ H ₅ | CN | H | F | O |
| | H | -N(CH ₃) ₂ | H | -NH-SO ₂ -C ₂ H ₅ | CN | H | Cl | O |
| 10 | H | -N(CH ₃) ₂ | Cl | F | CF ₃ | H | Cl | O |
| | H | -NH-CH ₃ | H | -O-CH(CH ₃)-C≡CH | CN | H | F | O |
| | H | -NH-CH ₃ | H | -NH-SO ₂ -C ₂ H ₅ | CN | H | F | O |
| 15 | H | -NH-CH ₃ | H | -O-CH(CH ₃) ₂ | CN | H | F | O |
| | H | -NH-CH ₃ | H | -O-CH(CH ₃)-CH ₂ -OCH ₃ | CN | H | F | O |
| | H | -NH-CH ₃ | H | -S-C ₂ H ₅ | CN | H | F | O |
| 20 | H | -NH-CH ₃ | H | -O-(CH ₂) ₂ -NH-CH ₃ | CN | H | F | O |
| | H | -NH-CH ₃ | H | OH | CN | H | F | O |
| | H | -NH-CH ₃ | H | -O-CH ₃ | CN | H | F | O |
| 25 | H | -NH-CH ₃ | H | SH | CN | H | F | O |
| | H | -NH-CH ₃ | H | -S-C ₂ H ₅ | CN | H | F | O |
| | H | -NH-CH ₃ | H | -NH-SO ₂ -CH ₃ | CN | H | F | O |
| 30 | H | -NH-CH ₃ | H | -O-CH ₂ -C≡CH | CN | H | F | O |
| | H | -N(CH ₃) ₂ | H | OH | CN | H | F | O |
| | H | -N(CH ₃) ₂ | H | -O-C ₂ H ₅ | CN | H | Cl | O |
| 35 | H | -NH-CH ₃ | H | -S-C ₂ H ₅ | CN | H | Cl | O |
| | H | -N(CH ₃) ₂ | H | -NH-SO ₂ -CH ₃ | CN | H | Cl | O |
| | H | -N(CH ₃) ₂ | H | -O-CH ₂ -C≡CH | CN | H | F | O |

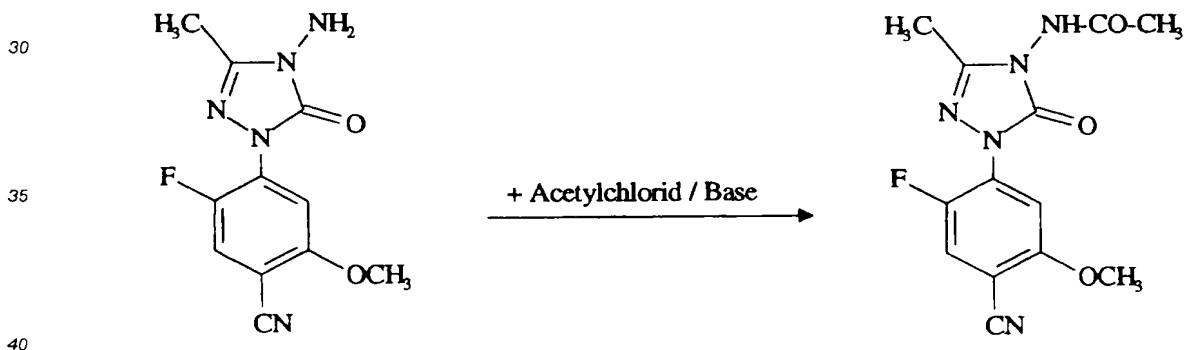
Verwendet man beispielsweise 3-Methyl-4-dimethylamino-1,2,4-triazolin-5-on und 2,4,5-Trifluorbenzonitril als Ausgangsstoffe, so lässt sich der Reaktionsablauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) durch das folgende Formelschema darstellen:



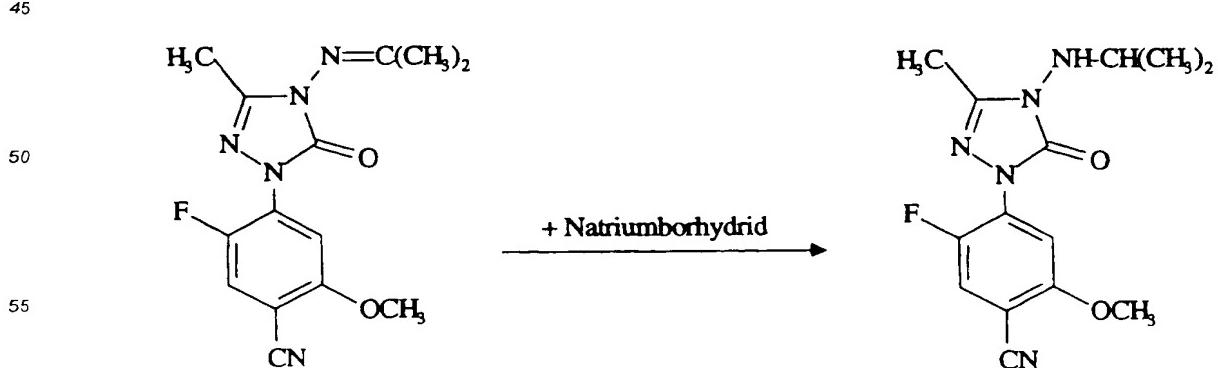
Verwendet man beispielsweise 1-(4-Cyano-2,5-difluorphenyl)-3-methyl-4-dimethylamino-1,2,4-triazolin-5-on und 1-Butin-3-ol als Ausgangsstoffe, so lässt sich der Reaktionsablauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (b) durch das folgende Formelschema darstellen:



Verwendet man beispielsweise 1-(4-Cyano-2-fluor-5-methoxy-phenyl)-4-amino-3-methyl-1,2,4-triazolin-5-on als Ausgangsverbindung und Acetylchlorid als Acylierungsmittel, so läßt sich der Reaktionsablauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (c) durch das folgende Formelschema darstellen:



Verwendet man beispielsweise 1-(4-Cyano-2-fluor-5-methoxy-phenyl)-3-methyl-4-isopropylidenimino-1,2,4-triazolin-5-on als Ausgangsverbindung und Natriumborhydrid als Reduktionsmittel, so lässt sich der Reaktionsablauf des erfundungsgemäßen Verfahrens (d) durch das folgende Formelschema darstellen:



Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) als Ausgangsstoffe benötigten 1H-Triazolinone sind durch die Formel (II) allgemein definiert. In dieser Formel (II) stehen R¹, R² und X vorzugsweise und besonders bevorzugt für diejenigen Reste, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) als bevorzugt und besonders bevorzugt für diese Substituenten genannt wurden.

Die 1H-Triazolinone der Formel (II) sind bekannt oder erhältlich in Analogie zu bekannten Verfahren (vergl. z.B. Chimica Acta Turcica 9, 381 [1981]; EP 399 294; EP 422 469; J. Heterocycl. Chem. 10, 387-390 [1973]; Indian J. Chem. 7, 959-963 [1969]; DE 37 19 575; DE 38 03 523; Liebigs Ann. Chem. 637, 135 [1960]; J. Heterocycl. Chem. 16, 403 [1979]; J. Heterocycl. Chem. 17, 1691 [1980]; J. Indian Chem. Soc. 57, 270-272 [1980]; Indian J. Chem. Sect. B 22B, 270-271 [1983]; Chem. Ber. 98, 3025 [1965]; JP 52-125168; Europ. J. Med. Chem. 18, 215 [1983]).

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) weiterhin als Ausgangsstoffe benötigten Halogenbenzol-Derivate sind durch die Formel (III) allgemein definiert. In dieser Formel (III) stehen R³, R⁴, R⁵, R⁶ und R⁷ vorzugsweise und besonders bevorzugt für diejenigen Reste, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) als bevorzugt und besonders bevorzugt für diese Substituenten genannt wurden. Hal¹ steht vorzugsweise für Fluor, Chlor oder Brom, insbesondere für Fluor oder Chlor.

Die Halogenbenzol-Derivate der Formel (III) sind allgemein bekannt oder erhältlich in Analogie zu bekannten Verfahren (vergl. z.B. EP 191 181; EP 441 004; EP 431 373). Noch nicht bekannt ist die Verbindung 5-Chlor-2,4-difluorbenzonitril. Man erhält sie, wenn man die bekannte Verbindung 2,4,5-Trichlorbenzonitril (vergl. z.B. EP 441 004) mit Kaliumfluorid gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels wie beispielsweise Tetramethylsulfon bei Temperaturen zwischen 100 °C und 200 °C umsetzt (vergleiche hierzu auch die Herstellungsbeispiele).

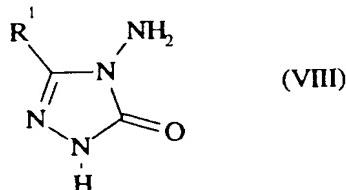
Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahren (b) als Edukte benötigten substituierten Triazolinone sind durch die Formel (Ia) allgemein definiert. In dieser Formel (Ia) stehen R¹, R², R³, R⁶, R⁵, R⁷ und X vorzugsweise und besonders bevorzugt für diejenigen Reste, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) als bevorzugt und besonders bevorzugt für diese Substituenten genannt wurden. Hal² steht vorzugsweise für Fluor, Chlor oder Brom, insbesondere für Fluor oder Chlor.

Die substituierten Triazolinone der Formel (Ia) erfindungsgemäße Verbindungen und erhältlich mit Hilfe der erfindungsgemäßen Verfahren (a), (c) und/oder (d).

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahren (b) weiterhin als Edukte benötigten Nukleophile sind durch die Formel (IV) allgemein definiert. In dieser Formel (IV) steht R¹³ vorzugsweise für einen Rest der Formel -O-R¹⁰, -S-R¹⁰ oder -NR¹¹R¹⁰, wobei R¹⁰ und R¹¹ vorzugsweise für diejenigen Reste stehen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) als bevorzugt und besonders bevorzugt für diese Substituenten genannt wurden. Die Nukleophile der Formel (IV) sind allgemein bekannte Verbindungen der organischen Chemie.

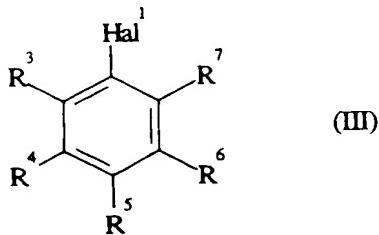
Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahren (c) als Edukte benötigten substituierten Triazolinone sind durch die Formel (V) allgemein definiert. In dieser Formel (V) stehen R¹, R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷ und X vorzugsweise und besonders bevorzugt für diejenigen Reste, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) als bevorzugt und besonders bevorzugt für diese Substituenten genannt wurden.

Die substituierten Triazolinone der Formel (V) sind noch nicht bekannt. Sie sind jedoch größtenteils Gegenstand von eigenen noch nicht veröffentlichten Patentanmeldungen und erhältlich mit Hilfe der dort beschriebenen Verfahren, beispielsweise indem man 4-Amino-1H-triazolinone der Formel (VIII),



55 in welcher
R¹ die oben angegebene Bedeutung hat,
mit Halogenbenzol-Derivaten der Formel (III),

5



10

in welcher

R^3, R^4, R^5, R^6 und R^7 die oben angegebenen Bedeutungen haben und
Hal¹ für Halogen steht,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Reaktions-
hilfsmittels in Analogie zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) umsetzt.

4-Amino-1H-triazolinone der Formel (VIII) sind bekannt oder erhältlich in Analogie zu bekannten
Verfahren (vergl. z.B. EP 294 666; J. Heterocycl. Chem. 10, 387-390 [1973]; Indian J. Chem. 7, 959-963
[1969]; DE 37 19 575; DE 38 03 523; Liebigs Ann. Chem. 637, 135 [1960]; J. Heterocycl. Chem. 16, 403
[1979]; J. Heterocycl. Chem. 17, 1691 [1980]; J. Indian Chem. Soc. 57, 270-272 [1980]; Indian J. Chem.
Sect. B 22B, 270-271 [1983]; Chem. Ber. 98, 3025 [1965]; JP 52-125168; Europ. J. Med. Chem. 18, 215
[1983]).

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahren (c) weiterhin als Edukte benötigten Alkylierungs-, Acylierungs- und Sulfonylierungsmittel sind durch die Formel (VI) allgemein definiert. In dieser Formel (VI) steht R^9 vorzugsweise und besonders bevorzugt für diejenigen Reste, die bereits im Zusam-
menhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) als bevorzugt und besonders
bevorzugt für diese Substituenten genannt wurden. E steht für einen üblichen elektronenanziehenden
Abgangsrest wie beispielsweise Halogen, insbesondere für Chlor, Brom oder Iod oder im Fall der
Alkylierungsmittel für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkylsulfonyloxy, Alkoxyssulfonyloxy oder Arylsul-
fonyloxy, wie insbesondere Methansulfonyloxy, Trifluormethansulfonyloxy, Methoxysulfonyloxy, Ethoxysulfo-
nyloxy oder p-Toluolsulfonyloxy.

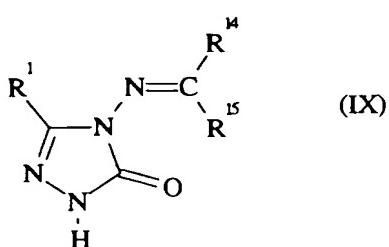
Die Alkylierungs-, Acylierungs- und Sulfonylierungsmittel der Formel (VI) sind allgemein bekannte Verbin-
dungen der organischen Chemie.

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahren (d) als Edukte benötigten substituierten 4-
Alkyldenimino-triazolinone sind durch die Formel (VII) allgemein definiert. In dieser Formel (VII) stehen R^1 ,
 R^3, R^4, R^5, R^6, R^7 und X vorzugsweise und besonders bevorzugt für diejenigen Reste, die bereits im
Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) als bevorzugt und
besonders bevorzugt für diese Substituenten genannt wurden. R^{14} steht vorzugsweise für Wasserstoff oder
für geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, insbesondere für Wasserstoff,
Methyl oder Ethyl. R^{15} steht vorzugsweise für jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkyl oder Alkoxy mit
jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, insbesondere für Methyl, Ethyl, Methoxy oder Ethoxy.

Die 4-Alkyldenimino-triazolinone der Formel (VII) sind noch nicht bekannt. Sie sind jedoch größtenteils
Gegenstand von eigenen noch nicht veröffentlichten Patentanmeldungen und erhältlich mit Hilfe der dort
beschriebenen Verfahren, beispielsweise indem man 4-Alkyldenimino-1H-triazolinone der Formel (IX),

45

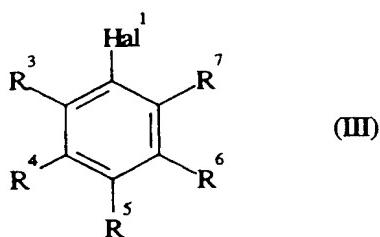
50



55

in welcher

R^1, R^{14} und R^{15} die oben angegebene Bedeutung haben,
mit Halogenbenzol-Derivaten der Formel (III),



10

in welcher

R^3 , R^4 , R^5 , R^6 und R^7 die oben angegebenen Bedeutungen haben und
Hal¹ für Halogen steht,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Reaktions-
15 hilfsmittels in Analogie zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) umsetzt.

4-Alkylenimino-1H-triazolinone der Formel (IX) sind bekannt oder erhältlich in Analogie zu bekannten
Verfahren (vergl. z.B. EP 294 666; EP 399 294).

Als Verdünnungsmittel zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) kommen inerte organische Lösungsmittel infrage. Hierzu gehören insbesondere aliphatische, alicyclische oder aromatische, gegebenenfalls halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Benzin, Benzol, Toluol, Xylool, Chlorbenzol, Dichlorbenzol, Petrolether, Hexan, Cyclohexan, Dichlormethan, Chloroform oder Tetrachlorkohlenstoff; Ether, wie Diethylether, Düsopropylether, Dioxan, Tetrahydrofuran oder Ethylenglykoldimethyl- oder -diethylether; Ketone, wie Aceton, Butanon oder Methyl-isobutyl-keton; Nitrile, wie Acetonitril, Propionitril oder Benzonitril; Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methylformanilid, N-Methylpyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid oder Ester, wie Essigsäuremethylester oder Essigsäureethylester.

Das erfindungsgemäße Verfahren (a) wird vorzugsweise in Gegenwart eines geeigneten Reaktionshilfsmittels durchgeführt. Als solche kommen alle üblichen anorganischen oder organischen Basen infrage. Hierzu gehören beispielsweise Erdalkali- oder Alkalimetallhydroxide, wie Natriumhydroxid, Calciumhydroxid, Kaliumhydroxid oder auch Ammoniumhydroxid, Alkalimetallcarbonate, wie Natriumcarbonat, Kaliumcarbonat, Kaliumhydrogencarbonat, Natriumhydrogencarbonat oder Ammoniumcarbonat, Alkali- oder Erdalkalimetallacetate, wie Natriumacetat, Kaliumacetat, Calciumacetat oder Ammoniumacetat, sowie tertiäre Amine, wie Trimethylamin, Triethylamin, Tributylamin, N,N-Dimethylanilin, Pyridin, Piperidin, N-Methylpiperidin, N,N-Dimethylaminopyridin, Diazabicyclooctan (DABCO), Diazabicyclononen (DBN) oder Diazabicycloundecen (DBU).

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen 0 °C und + 180 °C, vorzugsweise bei Temperaturen zwischen + 20 °C und + 120 °C.

Das erfindungsgemäße Verfahren (a) wird üblicherweise unter Normaldruck durchgeführt. Es ist jedoch auch möglich unter erhöhtem oder vermindertem Druck zu arbeiten.

Zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) setzt man pro Mol 1H-Triazolinon der Formel (II) im allgemeinen 1,0 bis 3,0 Mol, vorzugsweise 1,0 bis 1,5 Mol Halogenbenzol-Derivat der Formel (III) und gegebenenfalls 1,0 bis 3,0 Mol, vorzugsweise 1,0 bis 1,5 Mol Base als Reaktionshilfsmittel ein. Die Reaktionsdurchführung, Aufarbeitung und Isolierung der Reaktionsprodukte erfolgt nach allgemein üblichen, bekannten Verfahren (vergleiche auch die Herstellungsbeispiele).

Als Verdünnungsmittel zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (b) kommen inerte organische Lösungsmittel infrage. Vorzugsweise verwendet man die bei der Beschreibung der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) aufgezählten Lösungsmittel

Das erfindungsgemäße Verfahren (b) wird vorzugsweise in Gegenwart eines geeigneten Reaktionshilfsmittels durchgeführt. Als solche kommen alle üblichen anorganischen oder organischen Basen infrage. Hierzu gehören beispielsweise Erdalkali- oder Alkalimetallhydride, -hydroxide, -amide, -alkoholate, -acetate, -carbonate oder -hydrogencarbonate, wie beispielsweise Natriumhydrid, Natriumamid, Natriummethylat, Natriumethylat, Kalium-tert-butylat, Natriumhydroxid, Kaliumhydroxid, Ammoniumhydroxid, Natriumacetat, Kaliumacetat, Calciumacetat, Ammoniumacetat, Natriumcarbonat, Kaliumcarbonat, Kaliumhydrogencarbonat, Natriumhydrogencarbonat oder Ammoniumcarbonat sowie tertiäre Amine, wie Trimethylamin, Triethylamin, Tributylamin, N,N-Dimethylanilin, Pyridin, N-Methylpiperidin, N,N-Dimethylaminopyridin, Diazabicyclooctan (DABCO), Diazabicyclononen (DBN) oder Diazabicycloundecen (DBU).

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (b) in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen -20 °C und + 150 °C, vorzugsweise bei Temperaturen zwischen 0 °C und + 120 °C.

Das erfindungsgemäße Verfahren (b) wird üblicherweise unter Normaldruck durchgeführt. Es ist jedoch auch möglich unter erhöhtem oder vermindertem Druck zu arbeiten.

Zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (b) setzt man pro Mol substituiertem Triazolinon der Formel (Ia) im allgemeinen 1,0 bis 3,0 Mol, vorzugsweise 1,0 bis 1,5 Mol Nukleophil der Formel (IV) und gegebenenfalls 0,1 bis 3,0 Mol, vorzugsweise 1,0 bis 1,5 Mol Base als Reaktionshilfsmittel ein.

Die Reaktionsdurchführung, Aufarbeitung und Isolierung der Reaktionsprodukte erfolgt nach allgemein üblichen, bekannten Verfahren.

Als Verdünnungsmittel zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (c) kommen inerte organische Lösungsmittel infrage. Hierzu gehören insbesondere aliphatische, alicyclische oder aromatische, gegebenenfalls halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Benzin, Benzol, Toluol, Xylool, Chlorbenzol, Dichlorbenzol, Petrolether, Hexan, Cyclohexan, Dichlormethan, Chloroform, Tetrachlorkohlenstoff; Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Dioxan, Tetrahydrofuran oder Ethylenglykoldimethyl- oder -diethylether; Nitrile, wie Acetonitril, Propionitril oder Benzonitril; Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methylformanilid, N-Methylpyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid; Ester wie Essigsäuremethylester oder Essigsäureethylester oder Sulfoxide, wie Dimethylsulfoxid.

Das erfindungsgemäße Verfahren (c) kann gegebenenfalls auch in einem Zweiphasensystem, wie beispielsweise Wasser/Toluol oder Wasser/Dichlormethan, gegebenenfalls in Gegenwart eines geeigneten Phasentransferkatalysators, durchgeführt werden. Als Beispiele für solche Katalysatoren seien genannt: Tetrabutylammoniumiodid, Tetrabutylammoniumbromid, Tetrabutylammoniumchlorid, Tributyl-methylphosphoniumbromid, Trimethyl-C₁₃/C₁₅-alkylammoniumchlorid, Trimethyl-C₁₃/C₁₅-alkylammoniumbromid, Dimethyl-dimethyl-ammoniummethylsulfat, Dimethyl-C₁₂/C₁₄-alkyl-benzylammoniumchlorid, Dimethyl-C₁₂/C₁₄-alkyl-benzylammoniumbromid, Tetrabutylammoniumhydroxid, Triethylbenzylammoniumchlorid, Methyltriocetylbenzylammoniumchlorid, Trimethylbenzylammoniumchlorid, 15-Krone-5, 18-Krone-6 oder Tris-[2-(2-methoxyethoxy)-ethyl]-amin.

Das erfindungsgemäße Verfahren (c) wird vorzugsweise in Gegenwart eines geeigneten Reaktionshilfsmittels durchgeführt. Als solche kommen alle üblichen anorganischen oder organischen Basen infrage. Hierzu gehören beispielsweise Erdalkali- oder Alkalimetallhydride, -hydroxide, -amide, -alkoholate, -acetate, -carbonate oder -hydrogencarbonate, wie beispielsweise Natriumhydrid, Natriumamid, Natriummethylat, Natriummethyllat, Kalium-tert.-butylat, Natriumhydroxid, Kaliumhydroxid, Ammoniumhydroxid, Natriumacetat, Kaliumacetat, Calciumacetat, Ammoniumacetat, Natriumcarbonat, Kaliumcarbonat, Kaliumhydrogencarbonat, Natriumhydrogencarbonat oder Ammoniumcarbonat sowie tertiäre Amine, wie Trimethylamin, Triethylamin, Tributylamin, N,N-Dimethylaniolin, Pyridin, N-Methylpiperidin, N,N-Dimethylaminopyridin, Diazabicyclooctan (DABCO), Diazabicyclononen (DBN) oder Diazabicycloundecen (DBU).

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (c) in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen -20 °C und + 150 °C, vorzugsweise bei Temperaturen zwischen 0 °C und + 120 °C.

Das erfindungsgemäße Verfahren (c) wird üblicherweise unter Normaldruck durchgeführt. Es ist jedoch auch möglich unter erhöhtem oder vermindertem Druck zu arbeiten.

Zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (c) setzt man pro Mol substituiertem Triazolinon der Formel (V) im allgemeinen 1,0 bis 3,0 Mol, vorzugsweise 1,0 bis 2,0 Mol Akylierungs-, Acylierungs oder Sulfonylierungsmittel der Formel (VI) und gegebenenfalls 1,0 bis 3,0 Mol, vorzugsweise 1,0 bis 2,0 Mol Base als Reaktionshilfsmittel ein.

Die Reaktionsdurchführung, Aufarbeitung und Isolierung der Reaktionsprodukte erfolgt in beiden Fällen nach allgemein üblichen, bekannten Verfahren.

Als Reduktionsmittel zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (d) kommen übliche Reduktionsmittel infrage. Mit besonderem Vorzug verwendet man komplexe Hydride wie beispielsweise Lithiumaluminiumhydrid oder Natriumborhydrid.

Als Verdünnungsmittel zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (d) kommen in Abhängigkeit vom verwendeten Reduktionsmittel übliche organische oder anorganische Lösungsmittel infrage. Vorzugsweise verwendet man Alkohole, wie Methanol, Ethanol, Propanol oder Butanol, Etheralkohole, wie Methoxyethanol oder Ethoxyethanol, Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Dioxan oder Tetrahydrofuran, deren Gemische mit Wasser oder reines Wasser als Verdünnungsmittel.

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (d) in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen -20 °C und + 100 °C, vorzugsweise bei Temperaturen zwischen 0 °C und + 80 °C.

Das erfindungsgemäße Verfahrens (d) wird üblicherweise unter Normaldruck durchgeführt. Es ist jedoch auch möglich unter erhöhtem oder vermindertem Druck zu arbeiten.

Zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (d) setzt man pro Mol 4-Alkylenimino-triazolinon der Formel (VII) im allgemeinen 0,5 bis 5,0 Mol, vorzugsweise 1,0 bis 3,0 Mol Reduktionsmittel ein. Die Reaktionsdurchführung, Aufarbeitung und Isolierung der Reaktionsprodukte erfolgt nach allgemein üblichen, bekannten Verfahren.

Die Reinigung der Endprodukte der Formel (I) erfolgt mit Hilfe üblicher Verfahren, beispielsweise durch Säulenchromatographie oder durch Umkristallisieren. Die Charakterisierung erfolgt mit Hilfe des Schmelzpunktes oder bei nicht kristallisierenden Verbindungen mit Hilfe der Protonen-Kernresonanzspektroskopie (¹H-NMR).

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können als Defoliants, Desiccants, Krautabtötungsmittel und insbesondere als Unkrautvernichtungsmittel verwendet werden. Unter Unkraut im weitesten Sinne sind alle Pflanzen zu verstehen, die an Orten aufwachsen, wo sie unerwünscht sind. Ob die erfindungsgemäßen Stoffe als totale oder selektive Herbizide wirken, hängt im wesentlichen von der angewandten Menge ab.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können z.B. bei den folgenden Pflanzen verwendet werden:

Dikotyle Unkräuter der Gattungen: Sinapis, Lepidium, Galium, Stellaria, Matricaria, Anthemis, Galinsoga, Chenopodium, Urtica, Senecio, Amaranthus, Portulaca, Xanthium, Convolvulus, Ipomoea, Polygonum, Sesbania, Ambrosia, Cirsium, Carduus, Sonchus, Solanum, Rorippa, Rotala, Lindernia, Lamium, Veronica, Abutilon, Emex, Datura, Viola, Galeopsis, Papaver, Centaurea, Trifolium, Ranunculus, Taraxacum.

Dikotyle Kulturen der Gattungen: Gossypium, Glycine, Beta, Daucus, Phaseolus, Pisum, Solanum, Linum, Ipomoea, Vicia, Nicotiana, Lycopersicon, Arachis, Brassica, Lactuca, Cucumis, Cucurbita. Monokotyle Unkräuter der Gattungen: Echinochloa, Setaria, Panicum, Digitaria, Phleum, Poa, Festuca, Eleusine, Brachiaria, Lolium, Bromus, Avena, Cyperus, Sorghum, Agropyron, Cynodon, Monochoria, Fimbristylis, Sagittaria, Eleocharis, Scirpus, Paspalum, Ischaemum, Sphenoclea, Dactyloctenium, Agrostis, Alopecurus, Apera.

Monokotyle Kulturen der Gattungen: Oryza, Zea, Triticum, Hordeum, Avena, Secale, Sorghum, Panicum, Saccharum, Ananas, Asparagus, Allium.

Die Verwendung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe ist jedoch keineswegs auf diese Gattungen beschränkt, sondern erstreckt sich in gleicher Weise auch auf andere Pflanzen.

Die Verbindungen eignen sich in Abhängigkeit von der Konzentration zur Totalunkrautbekämpfung z.B. auf Industrie- und Gleisanlagen und auf Wegen und Plätzen mit und ohne Baumbewuchs. Ebenso können die Verbindungen zur Unkrautbekämpfung in Dauerkulturen, z.B. Forst, Ziergehölz-, Obst, Wein-, Zitrus-, Nuß-, Bananen-, Kaffee-, Tee-, Gummi-, Ölbaum-, Kakao-, Beerenfrucht- und Hopfenanlagen und zur selektiven Unkrautbekämpfung in einjährigen Kulturen eingesetzt werden.

Dabei lassen sich die erfindungsgemäßen Wirkstoffe mit besonders gutem Erfolg zur Bekämpfung von dikotylen Unkräutern in mono- und dikotylen Kulturen wie beispielsweise Soja, Sonnenblumen oder Gerste einsetzen. Daneben besitzen die erfindungsgemäßen Wirkstoffe in entsprechenden Aufwandmengen auch fungizide Wirksamkeit und lassen sich zur Bekämpfung von Reiskrankheiten, wie beispielsweise gegen den Erreger der Reisfleckenkrankheit (*Pyricularia oryzae*) einsetzen.

Die Wirkstoffe können in Abhängigkeit von ihren jeweiligen physikalischen und/oder chemischen Eigenschaften in die üblichen Formulierungen übergeführt werden, wie Lösungen, Emulsionen, Suspensionen, Pulver, Schäume, Pasten, Granulate, Aerosole, Wirkstoff-imprägnierte Natur- und synthetische Stoffe, Feinstverkapselungen in polymeren Stoffen und in Hüllmassen für Saatgut, ferner in Formulierungen mit Brennsätzen, wie Räucherpatronen, -dosen, -spiralen u.ä., sowie ULV-Kalt- und Warmnebel-Formulierungen.

Diese Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z.B. durch Vermischen der Wirkstoffe mit Streckmitteln, also flüssigen Lösungsmitteln, unter Druck stehenden verflüssigten Gasen und/oder festen Trägerstoffen, gegebenenfalls unter Verwendung von oberflächenaktiven Mitteln, also Emulgiermitteln und/oder Dispergiermitteln und/oder schaumerzeugenden Mitteln. Im Falle der Benutzung von Wasser als Streckmittel können z.B. auch organische Lösungsmittel als Hilfslösungsmittel verwendet werden. Als flüssige Lösungsmittel kommen im wesentlichen infrage: Aromaten, wie Xylol, Toluol oder Alkylnaphthaline, chlorierte Aromaten oder chlorierte aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Chlorbenzole, Chlorethylen oder Methylenchlorid, aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Cyclohexan oder Paraffine, z.B. Erdölfaktionen, Alkohole, wie Butanol oder Glycol sowie deren Ether und Ester, Ketone, wie Aceton, Methylethyleketon, Methylisobutylketon oder Cyclohexanon, stark polare Lösungsmittel, wie Dimethylformamid und Dimethylsulfoxid, sowie Wasser; mit verflüssigten gasförmigen Streckmitteln oder Trägerstoffen sind solche Flüssigkeiten gemeint, welche bei normaler Temperatur und unter Normaldruck gasförmig sind, z.B. Aerosol-Treibgase, wie Halogenkohlenwasserstoffe sowie Butan, Propan, Stickstoff und Kohlendioxid; als feste Trägerstoffe kommen infrage: z.B. natürliche Gesteinsmehle, wie Kaoline, Tonerden, Talkum, Kreide, Quarz, Attapulgit, Montmorillonit oder Diatomeenerde und synthetische Gesteinsmehle, wie hochdisperse Kiesel-

säure, Aluminiumoxid und Silikate; als feste Trägerstoffe für Granulate kommen infrage: z.B. gebrochene und fraktionierte natürliche Gesteine wie Calcit, Marmor, Bims, Sepiolith, Dolomit sowie synthetische Granulate aus anorganischen und organischen Mehlen sowie Granulate aus organischem Material wie Sägemehl, Kokosnußschalen, Maiskolben und Tabakstengel; als Emulgier- und oder schaumerzeugende

- 5 Mittel kommen infragen: z.B. nichtionogene und anionische Emulgatoren, wie Polyoxyethylen-Fettsäure-Ester, Polyoxyethylen-Fettalkohol-Ether, z.B. AlkylarylpolyglykolEther, Alkylsulfonate, Alkylsulfate, Arylsulfonate sowie Eiweißhydrolysate; als Dispergiermittel kommen infrage: z.B. Lignin-Sulfitablaugen und Methylcellulose.

Es können in den Formulierungen Haftmittel wie Carboxymethylcellulose, natürliche und synthetische

- 10 pulverige, körnige oder latexförmige Polymere verwendet werden, wie Gummiarabicum, Polyvinylalkohol, Polyvinylacetat, sowie natürliche Phospholipide, wie Kephaline und Lecithine, und synthetische Phospholipide. Weitere Additive können mineralische und vegetabile Öle sein.

Es können Farbstoffe wie anorganische Pigmente, z.B. Eisenoxid, Titanoxid, Ferrocyanblau und organische Farbstoffe, wie Alizarin-, Azo- und Metallphthalocyaninfarbstoffe und Spurenährstoffe wie Salze von

- 15 Eisen, Mangan, Bor, Kupfer, Kobalt, Molybdän und Zinn verwendet werden.

Die Formulierungen enthalten im allgemeinen zwischen 0,1 und 95 Gewichtsprozent Wirkstoff, vorzugsweise zwischen 0,5 und 90%.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können als solche oder in ihren Formulierungen auch in Mischung mit bekannten Herbiziden zur Unkrautbekämpfung Verwendung finden, wobei Fertigformulierungen oder

- 20 Tankmischungen möglich sind.

Für die Mischungen kommen bekannt Herbicide infrage, beispielsweise Anilide, wie z.B. Diflufenican und Propanil; Arylcabonsäuren, wie z.B. Dichlorpicolinsäure, Dicamba oder Picloram; Aryloxyalkansäuren, wie z.B. 2,4-D, 2,4-DB, 2,4-DP, Fluroxypyr, MCPA, MCPP und Triclopyr; Aryloxy-phenoxy-alkansäureester, wie z.B. Diclofop-methyl, Fenoxaprop-ethyl, Fluazifop-butyl, Haloxyfop-methyl und Quizalofop-ethyl; Azinone,

- 25 wie z.B. Chloridazon und Norflurazon; Carbamate, wie z.B. Chlorpropham, Desmedipharm, Phenmedipharm und Propham; Chloracetanilide, wie z.B. Alachlor, Acetochlor, Butachlor, Metazachlor, Metolachlor, Pretilachlor und Propachlor; Dinitroaniline, wie z.B. Oryzalin, Pendimethalin und Trifluralin; Diphenylether, wie z.B. Acifluorfen, Bifenox, Fluoroglycofen, Fomesafen, Halosafen, Lactofen und Oxyfluorfen; Harnstoffe, wie z.B. Chlortoluron, Diuron, Fluometuron, Isoproturon, Linuron und Methabenzthiazuron; Hydroxylamine, wie z.B.

- 30 Alloxydim, Clethodim, Cycloxydim, Sethoxydim und Tralkoxydim; Imidazolinone, wie z.B. Imazethapyr, Imazamethabenz, Imazapyr und Imazaquin; Nitrile, wie z.B. Bromoxynil, Dichlobenil und Ioxynil; Oxyacetamide, wie z.B. Mefenacet; Sulfonylharnstoffe, wie z.B. Amidosulfuron, Bensulfuron-methyl, Chlorimuron-ethyl, Chlorsulfuron, Cinosulfuron, Metsulfuron-methyl, Nicosulfuron, Primisulfuron, Pyrazosulfuron-ethyl, Thifensulfuron-methyl, Triasulfuron und Tribenuron-methyl; Thiolcarbamate, wie z.B. Butylate, Cycloate,

- 35 Diallate, EPTC, Esprocarb, Molinate, Prosulfocarb, Thiobencarb und Triallate; Triazine, wie z.B. Atrazin, Cyanatin, Simazin, Simetryne, Terbutryne und Terbutylazin; Triazinone, wie z.B. Hexazinon, Metamitron und Methbuzin; Sonstige, wie z.B. Aminotriazol, Benfuresate, Bentazone, Cinmethylin, Clomazone, Clopyralid, Difenzoquat, Dithiopyr, Ethofumesate, Fluorochloridone, Glufosinate, Glyphosate, Isoxaben, Pyridate, Quinchlorac, Quinmerac, Sulphosate und Tridiphane.

- 40 Auch eine Mischung mit anderen bekannten Wirkstoffen, wie Fungiziden, Insektiziden, Akariziden, Nematiziden, Schutzstoffen gegen Vogelfraß, Pflanzennährstoffen und Bodenstrukturverbesserungsmitteln ist möglich.

Die Wirkstoffe können dabei als solche, in Form ihrer Formulierungen oder den daraus durch weiteres Verdünnen bereiteten Anwendungsformen, wie gebrauchsfertige Lösungen, Suspensionen, Emulsionen,

- 45 Pulver, Pasten und Granulate angewandt werden. Die Anwendung geschieht in üblicher Weise, z.B. durch Gießen, Spritzen; Sprühen, Streuen.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können sowohl vor als auch nach dem Auflaufen der Pflanzen appliziert werden. Sie können auch vor der Saat in den Boden eingearbeitet werden.

Die angewandte Wirkstoffmenge kann in einem größeren Bereich schwanken. Sie hängt im wesentlichen von der Art des gewünschten Effektes ab. Im allgemeinen liegen die Aufwandmengen zwischen 0,01

- 50 und 10 kg Wirkstoff pro Hektar Bodenfläche, vorzugsweise zwischen 0,05 und 5 kg pro Hektar.

Die Herstellung und die Verwendung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe geht aus den nachfolgenden Beispielen hervor.

Herstellungsbeispiele:Beispiel 1:

5

10

15

20 (Verfahren a)

71 g (0,5 Mol) 4-Dimethylamino-3-methyl-1H-1,2,4-triazolin-5-on (vergl. z.B. EP 422 469) und 78,5 g (0,5 Mol) 2,4,5-Trifluorbenzonitril (vergl. z.B. EP 191 181) werden in 400 ml Dimethylsulfoxid bei Raumtemperatur mit 83g (0,06 Mol) Kaliumcarbonat versetzt und anschließend zwei Stunden bei 40 °C bis 50 °C gerührt. Zur Aufarbeitung wird die abgekühlte Reaktionsmischung filtriert, das Filtrat im Vakuum eingeengt, der Rückstand mit Wasser verrührt, der ausgefallene Feststoff abgesaugt, mit Wasser gewaschen und getrocknet.

Man erhält 111 g (80 % der Theorie) 1-(4-Cyano-2,5-difluorphenyl)-3-methyl-4-dimethylamino-1,2,4-triazolin-5-on vom Schmelzpunkt 116 °C.

30 Beispiel 2:

35

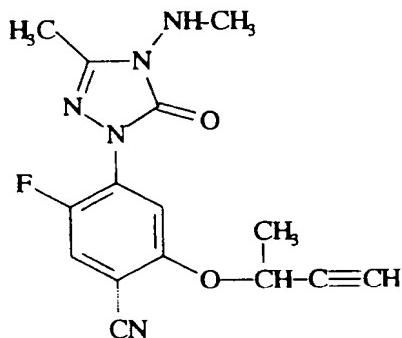
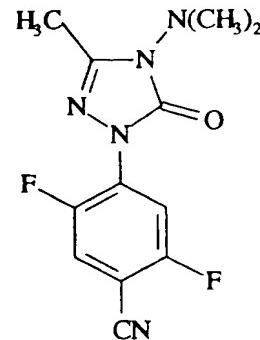
40

45

(Verfahren b)

Zu 1,05 g (0,015 Mol) 3-Butin-1-ol in 100 ml Acetonitril gibt man bei Raumtemperatur 0,6 g (0,015 Mol) 50 Natriumhydrid (60% in Paraffinöl), röhrt 10 Minuten bei Raumtemperatur, gibt anschließend 2,12 g (0,008 Mol) 1-(4-Cyano-2,5-difluorphenyl)-3-methyl-4-(N-methylamino)-1,2,4-triazolin-5-on zu und röhrt weitere 16 Stunden bei Raumtemperatur. Zur Aufarbeitung wird die Reaktionsmischung filtriert, das Filtrat im Vakuum eingeengt, der Rückstand mit Wasser verrührt, der ausgefallene Feststoff abgesaugt, mit Wasser gewaschen und getrocknet.

55 Man erhält 1,96 g (78 % der Theorie) 1-(4-Cyano-2-fluor-5-but-1-in-3-yl-oxyphenyl)-3-methyl-4-(N-methylamino)-1,2,4-triazolin-5-on vom Schmelzpunkt 184-185 °C.

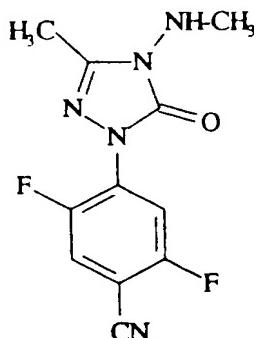


Beispiel 3:

5

10

15



(Verfahren a)

20 12,8 g (0,1 Mol) 4-(N-Methylamino)-3-methy-1H-1,2,4-triazolin-5-on (vergl. z.B. EP 399 294) und 15,7 g (0,1 Mol) 2,4,5-Trifluorbenzonitril (vergl. z.B. EP 191 181) werden in 200 ml Dimethylsulfoxid bei Raumtemperatur mit 16,5 g (0,12 Mol) Kaliumcarbonat versetzt und anschließend drei Stunden bei 40 °C bis 50 °C gerührt. Zur Aufarbeitung wird die abgekühlte Reaktionsmischung filtriert, das Filtrat im Vakuum eingeengt, der Rückstand mit Wasser verrührt, der ausgefallene Feststoff abgesaugt, mit Wasser gewaschen und getrocknet.

25 Man erhält 12,8 g (48 % der Theorie) 1-(4-Cyano-2,5-difluor-phenyl)-3-methyl-4-(N-methylamino)-1,2,4-triazolin-5-on vom Schmelzpunkt 128-131 °C.

Beispiel 4:

30

35

40

45

(verfahren a)

50 1,9 g (0,012 Mol) 3-Methyl-4-(N-isopropylamino)-1H-1,2,4-triazolin-5-on (Herstellung analog EP 399 294) und 1,9 g (0,012 Mol) 2,4,5-Trifluorbenzonitril (vergl. z.B. EP 191 181) werden in 100 ml Dimethylsulfoxid bei Raumtemperatur mit 1,9 g (0,014 Mol) Kaliumcarbonat versetzt und anschließend zwei Stunden bei Raumtemperatur und 1,5 Stunden bei 40-50 °C gerührt. Zur Aufarbeitung wird die abgekühlte Reaktionsmischung in Wasser gegeben, der ausgefallene Feststoff abgesaugt, mit Wasser gewaschen und getrocknet.

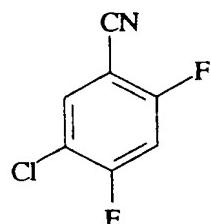
55 Man erhält 1,3 g (54,3 % der Theorie) 1-(4-Cyano-2,5-difluorphenyl)-3-methyl-4-(N-isopropylamino)-1,2,4-triazolin-5-on vom Schmelzpunkt 35-36 °C.

Herstellung der Ausgangsverbindungen:

Beispiel III-1:

5

10



15

Zu 250 g (4,31 Mol) Kaliumfluorid in 400 ml destilliertem Tetramethylensulfon gibt man unter Rühren bei Raumtemperatur 220 g (1,06 Mol) 2,4,5-Trichlorbenzonitril (vergl. z.B. EP 441 004) und röhrt anschließend 10 Stunden bei 195 °C bis 200 °C. Zur Aufarbeitung wird abgekühlt, 500 ml Wasser zugegeben und die Mischung einer Wasserdampfdestillation unterzogen. Der organische Anteil wird in Dichlormethan aufgenommen, über Natriumsulfat getrocknet, im Vakuum eingeengt und destilliert.

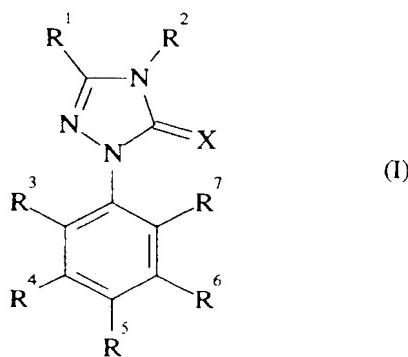
Man erhält 108 g (58 % der Theorie) 2,4-Difluor-5-chlorbenzonitrile vom Siedepunkt 105-107 °C bei 30 mbar und vom Schmelzpunkt 48-50 °C.

In entsprechender Weise und gemäß den allgemeinen Angaben zur Herstellung erhält man die folgenden substituierten Triazolinone der allgemeinen Formel (I):

25

30

35

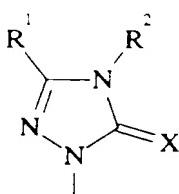
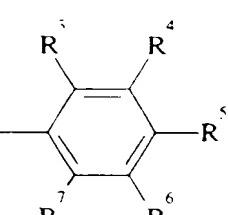
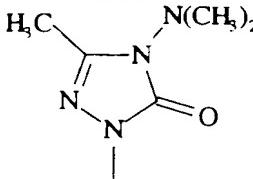
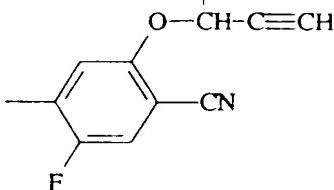
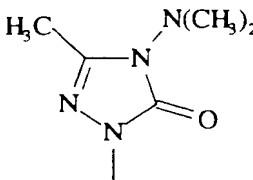
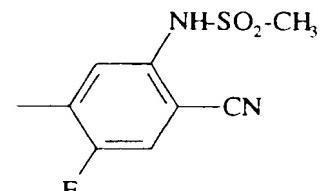


40

45

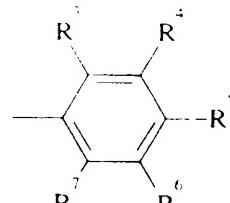
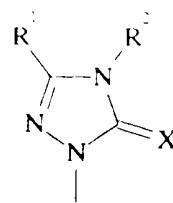
50

55

| Bsp. Nr. |  |  | physikalische Eigenschaften |
|----------|---|--|--------------------------------|
| 5 |  |  | Fp. 120-122°C |
| 6 |  |  | Fp. 211-213°C |
| 30 | | | |
| 35 | | | |
| 40 | | | |
| 45 | | | |
| 50 | | | |
| 55 | | | |

| Bsp. Nr. | | | physikalische Eigenschaften |
|----------|--|--|--|
| 7 | | | Fp. >250°C |
| 8 | | | Fp. 81°C |
| 9 | | | $^1\text{H-NMR}^*:$ 1,73-1,75; 3,0; 4,92-5,0 |
| 10 | | | $^1\text{H-NMR}^*:$ 2,6-2,7; 3,02; 4,85 |
| 11 | | | $^1\text{H-NMR}^*:$ 2,30; 3,0; 4,25-4,30 |

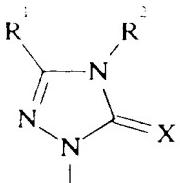
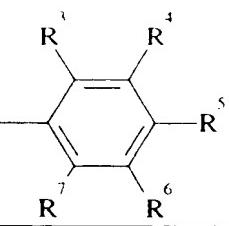
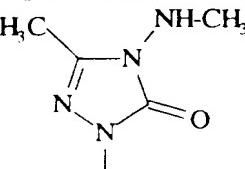
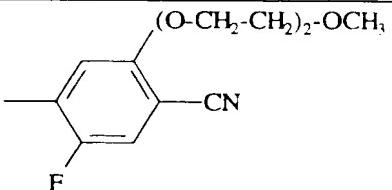
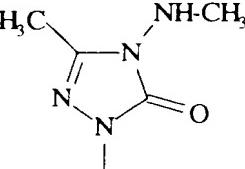
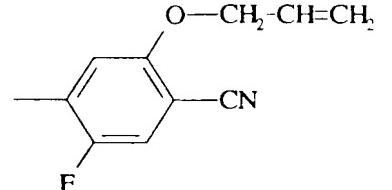
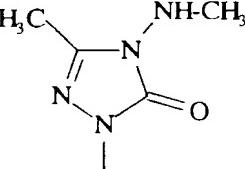
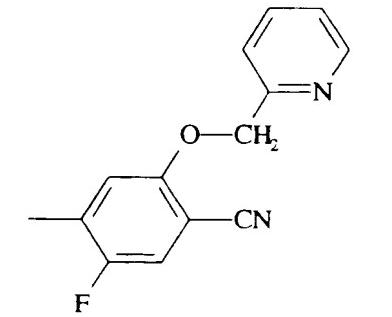
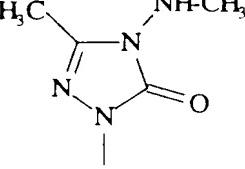
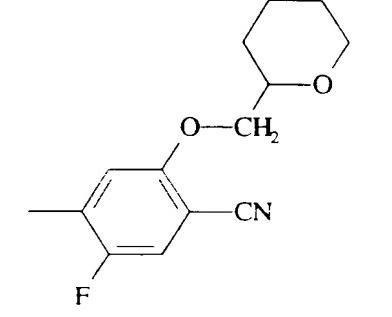
5 Bsp. Nr.

physikalische
Eigenschaften

| | | | | |
|----|----|--|--|--|
| 10 | 12 | | | ¹ H-NMR *): 2,6-2,7; 3,0; 3,4; 4,25-4,3 |
| 15 | 13 | | | Fp. 154°C |
| 20 | 14 | | | Fp. 192-193°C |
| 25 | 15 | | | Fp. 160-161°C |
| 30 | 16 | | | Fp. 67-68°C |
| 35 | | | | |
| 40 | | | | |
| 45 | | | | |

50

55

| Bsp. Nr. |  |  | physikalische Eigenschaften |
|----------|---|--|--|
| 17 |  |  | ^{1H-NMR} *): 2,35; 2,76- 2,79; 3,4; 4,25-4,3 |
| 18 |  |  | Fp. 137-138°C |
| 19 |  |  | Fp. 168-169°C |
| 20 |  |  | Fp. 158-160°C |

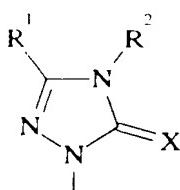
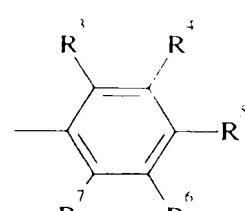
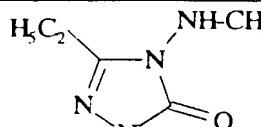
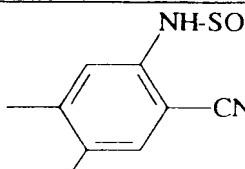
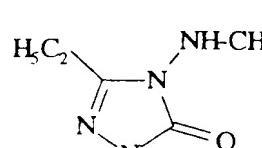
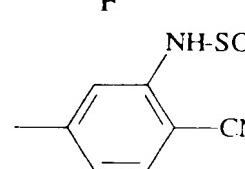
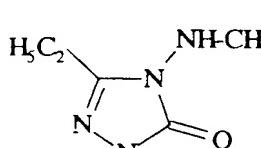
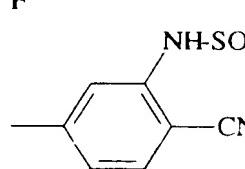
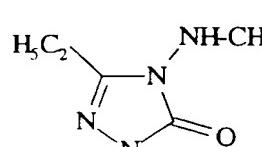
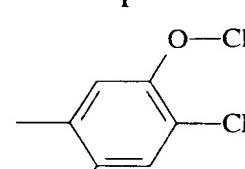
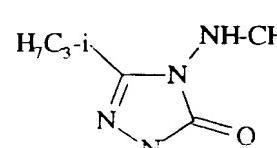
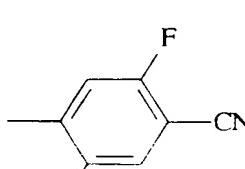
50

55

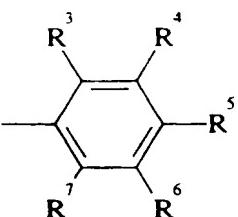
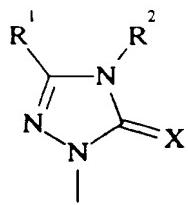
| Bsp. Nr. | | | physikalische Eigenschaften |
|----------|--|--|--------------------------------|
| 21 | | | Fp. 107-109°C |
| 22 | | | Fp. 87°C |
| 23 | | | Fp. 185-187°C |
| 24 | | | Fp. 106°C |
| 25 | | | Fp. 144-145°C |

50

55

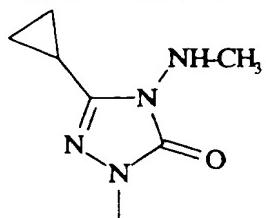
| Bsp. Nr. |  |  | physikalische Eigenschaften |
|----------|---|---|---|
| 10 | 26 |  |  Fp. 170°C |
| 15 | 27 |  |  Fp. 183-185°C |
| 20 | 28 |  |  Fp. 176°C |
| 25 | 29 |  |  Fp. 100-102°C |
| 30 | 30 |  |  Fp. 112-113°C |
| 35 | | | |
| 40 | | | |
| 45 | | | |
| 50 | | | |
| 55 | | | |

5

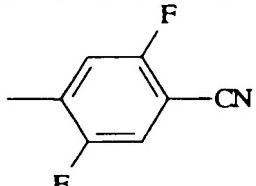
Bsp. Nr.**physikalische
Eigenschaften**

10

31

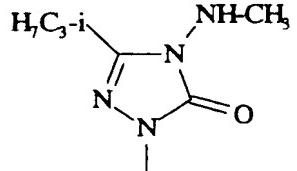


Fp. 136-138°C

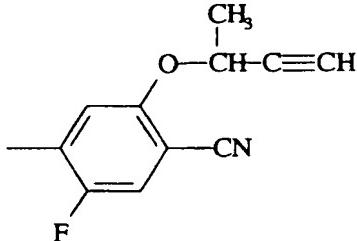


15

32

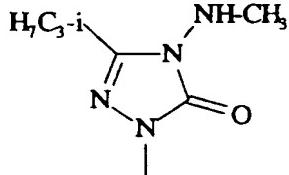


Fp. 121-123°C

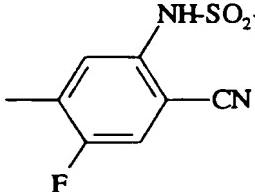


20

33

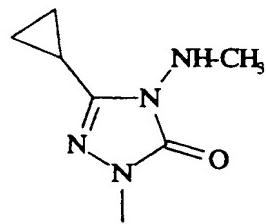


Fp. 168-170°C

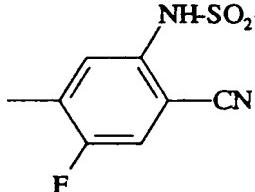


25

34

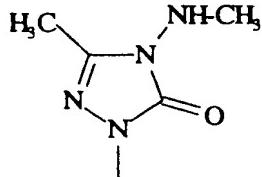


Fp. 155-157°C

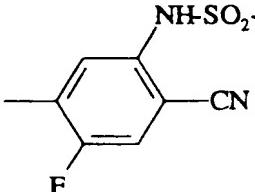


30

35



Fp. 202-204°C



35

50

55

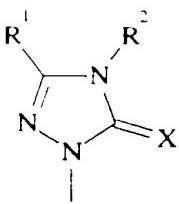
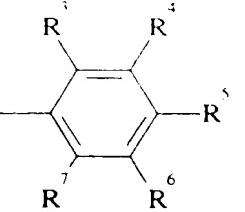
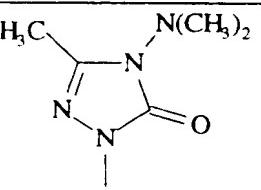
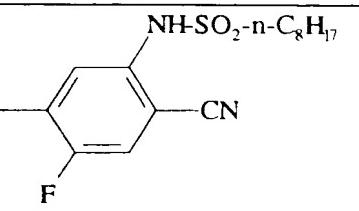
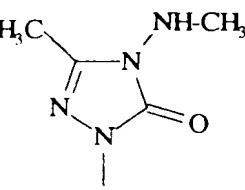
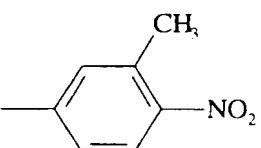
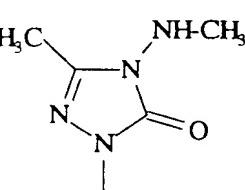
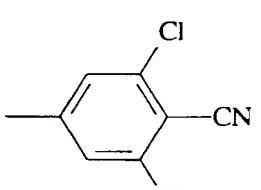
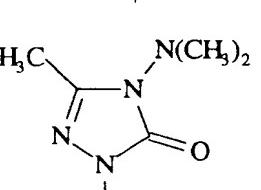
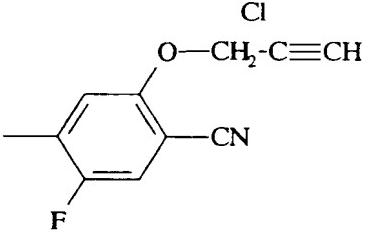
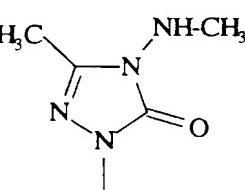
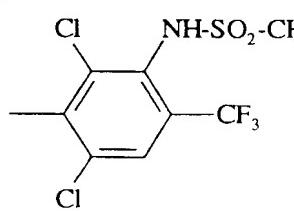
| 5 Bsp. Nr. | 10 36 | 15 37 | 20 38 | 25 39 | 30 40 | physikalische Eigenschaften |
|---------------|----------|----------|----------|----------|----------|--------------------------------|
| | | | | | | |
| | | | | | | |
| | | | | | | |
| 10 | 36 | 15 37 | 20 38 | 25 39 | 30 40 | Fp. 188-190°C |
| 15 | | | | | | |
| 20 | | | | | | |
| 25 | | | | | | |
| 30 | | | | | | |
| 35 | | | | | | |
| 40 | | | | | | |
| 45 | | | | | | |
| 50 | | | | | | |
| 55 | | | | | | |

| 5 | Bsp. Nr. | | | physikalische Eigenschaften |
|----|----------|--|--|--------------------------------|
| 10 | 41 | | | Fp. 106-108°C |
| 15 | 42 | | | Fp. 146-148°C |
| 20 | 43 | | | Fp. 125-126°C |
| 25 | 44 | | | Fp. 107-108°C |
| 30 | 45 | | | Fp. 115-118°C |
| 35 | | | | |
| 40 | | | | |
| 45 | | | | |

50

55

| Bsp. Nr. | Chemical Structure 1 | Chemical Structure 2 | physikalische Eigenschaften |
|----------|----------------------|----------------------|--|
| 5 | | | |
| 10 | 46 | | Fp. 85-87°C |
| 15 | | | |
| 20 | 47 | | $^1\text{H-NMR}^*:$ 2,22; 2,98; 4,68-4,75; 6,9-6,95 |
| 25 | | | |
| 30 | 48 | | Fp. 115-116°C |
| 35 | | | |
| 40 | 49 | | Fp. 153-158°C |
| 45 | | | |
| 50 | | | |
| 55 | | | |

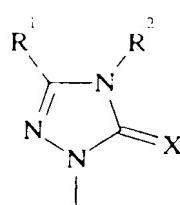
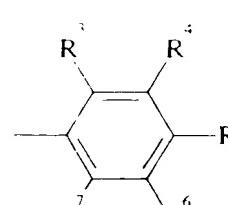
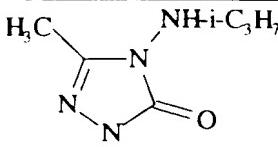
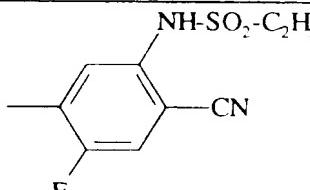
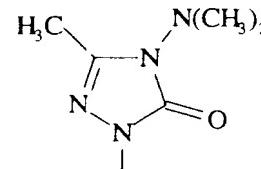
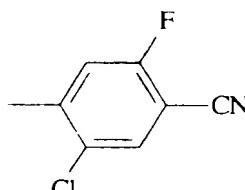
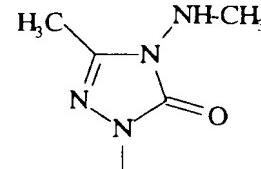
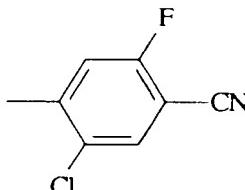
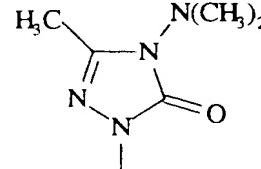
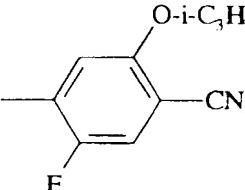
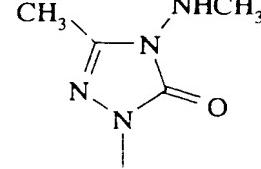
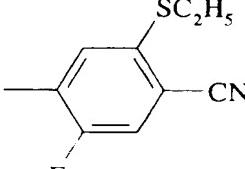
| | Bsp. Nr. |  |  | physikalische Eigenschaften |
|----|----------|---|--|--------------------------------|
| 5 | | | | |
| 10 | 50 |  |  | Fp. 151-152°C |
| 15 | 51 |  |  | Fp. 178-179°C |
| 20 | 52 |  |  | Fp. 227-228°C |
| 25 | 53 |  |  | Fp. 87-89°C |
| 30 | 54 |  |  | Fp. 187-188°C |
| 35 | | | | |
| 40 | | | | |
| 45 | | | | |
| 50 | | | | |
| 55 | | | | |

| Bsp. Nr. | | | physikalische Eigenschaften |
|----------|--|--|--------------------------------|
| 55 | | | Fp. 160-161°C |
| 56 | | | Fp. 95-97°C |
| 57 | | | Fp. 113°C |
| 58 | | | Fp. 212-214°C |
| 45 | | | |
| 50 | | | |
| 55 | | | |

| Bsp. Nr. | | | physikalische Eigenschaften |
|----------|--|--|---|
| 59 | | | ¹ H-NMR *): 2,52; 7,55-7,65 |
| 60 | | | ¹ H-NMR *): 7,55-7,60 |
| 61 | | | Fp. 121-123°C |
| 62 | | | Fp. 150-151°C |
| 63 | | | ¹ H-NMR *): 1,45; 3,2-3,25; 7,7; 7,95-7,98 |

50

55

| | Bsp. Nr. |  |  | physikalische Eigenschaften |
|----|----------|---|--|--|
| 5 | | | | |
| 10 | 64 |  |  | $^1\text{H-NMR}^*)$: 1,1-1,12; 2,3; 3,65-3,75; 4,58 |
| 15 | 65 |  |  | Fp. 130°C |
| 20 | 66 |  |  | Fp. 101°C |
| 25 | 67 |  |  | $^1\text{H-NMR}^*)$: 1,40-1,42; 2,3; 3,0; 4,6-4,7 |
| 30 | 68 |  |  | Fp. 117-119°C |
| 35 | | | | |
| 40 | | | | |
| 45 | | | | |
| 50 | | | | |
| 55 | | | | |

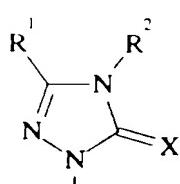
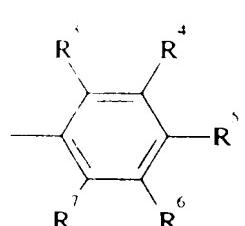
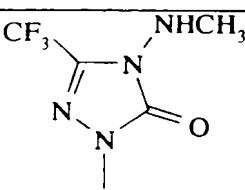
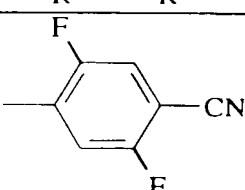
| Bsp. Nr. | | | physikalische Eigenschaften |
|----------|--|--|--------------------------------|
| 69 | | | Fp. 151-152°C |
| 70 | | | Fp. 84-86°C |
| 71 | | | Fp. 137-138°C |
| 72 | | | Fp. 117-119°C |
| 73 | | | Fp. 120-122°C |

45

50

55

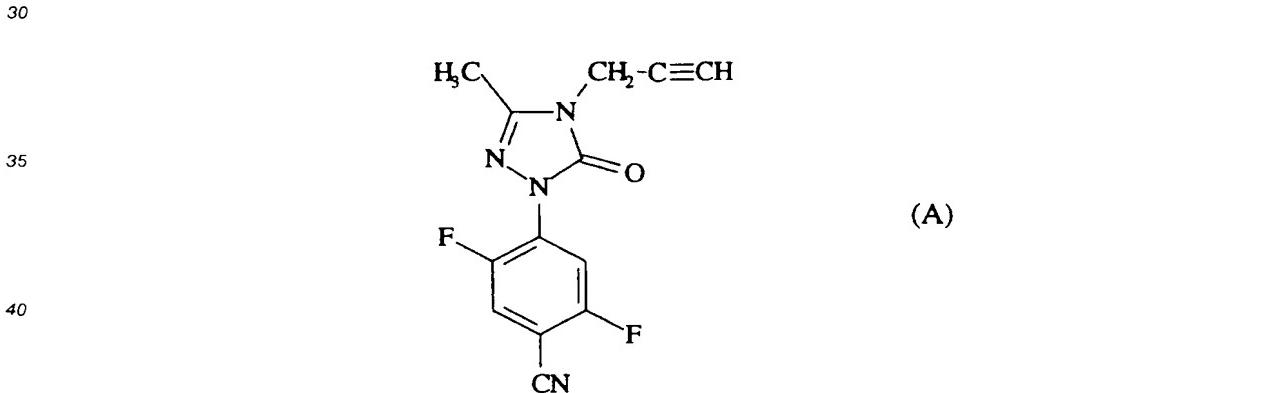
| 5 Bsp. Nr. | 10 Chemical Structure 1 | 15 Chemical Structure 2 | 20 physikalische Eigenschaften |
|---------------|----------------------------|----------------------------|--------------------------------------|
| 74 | | | Fp. 161°C |
| 75 | | | Fp. 149°C |
| 76 | | | Fp. 143°C |
| 77 | | | Fp. 89°C |
| 78 | | | Fp. 103°C |
| 45 | | | |
| 50 | | | |
| 55 | | | |

| Bsp. Nr. |  $\begin{array}{c} \text{R}^1 \\ \\ \text{N}=\text{C}(\text{X})-\text{C}(\text{R}^2)=\text{N} \\ \\ \text{N} \end{array}$ |  $\begin{array}{c} \text{R}' \\ \\ \text{R} \\ =\text{C}_6\text{H}_3(\text{R})_2\text{R}' \\ \\ \text{R} \\ \\ \text{R} \end{array}$ | physikalische Eigenschaften | |
|----------|---|---|--|-----------|
| 10 | 79 |  $\begin{array}{c} \text{CF}_3 \\ \\ \text{N}=\text{C}(\text{NHCH}_3)-\text{C}(\text{R})=\text{N} \\ \\ \text{N} \end{array}$ |  $\begin{array}{c} \text{F} \\ \\ \text{C}_6\text{H}_3(\text{F})_2\text{CN} \\ \\ \text{F} \end{array}$ | Fp. 145°C |
| 15 | | | | |

*) Die ^1H -NMR-Spektren wurden in Deuterochloroform (CDCl_3) mit Tetramethylsilan (TMS) als innerem Standard aufgenommen. Angegeben ist die chemische Verschiebung als δ -Wert in ppm.

25 Anwendungsbeispiele:

In dem folgenden Anwendungsbeispiel wurde die nachstehend aufgeführte Verbindung als Vergleichsstoff eingesetzt:



45 3-Methyl-4-propargyl-1-(2,5-difluorophenyl)-1,2,4-triazolin-5-one
(bekannt aus DE 38 39 480)

Beispiel A:

50 **Pre-emergence-Test**

Lösungsmittel: 5 Gewichtsteile Aceton

Emulgator: 1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykolether

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man ein Gewichtsteil Wirkstoff mit der angegebenen Menge Lösungsmittel, gibt die angegebene Menge Emulgator zu und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

Samen der Testpflanzen werden in normalen Boden ausgesät und nach 24 Stunden mit der Wirkstoffzubereitung begossen. Dabei hält man die Wassermenge pro Flächeneinheit zweckmäßigerweise konstant.

Die Wirkstoffkonzentration in der Zubereitung spielt keine Rolle, entscheidend ist nur die Aufwandmenge des Wirkstoffes pro Flächeneinheit. Nach drei Wochen wird der Schädigungsgrad der Pflanzen bonitiert in % Schädigung im Vergleich zur Entwicklung der unbehandelten Kontrolle.

Es bedeuten:

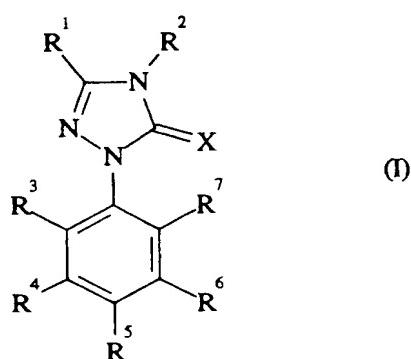
- 5 0 % = keine Wirkung (wie unbehandelte Kontrolle)
 100 % = totale Vernichtung

Eine deutliche Überlegenheit in der Wirksamkeit gegenüber dem Stand der Technik (A) zeigen in diesem Test z.B. die Verbindungen gemäß den Herstellungsbeispielen 5 und 6 in Kulturen wie Soja, Sonnenblumen und Gerste bei Aufwandmengen von 250 g/ha (Soja 0 bis 30 %, Sonnenblumen 0 %, Gerste 0 bis 100 %)

- gegenüber Unkräutern wie *Abutilon* (95 bis 100 %), *Chenopodium* (100 %), *Galium* (80 bis 95 %), *Matricaria* (95 bis 100 %) und *Solanum* (95 bis 100 %), auch wenn der Stand der Technik mit einer Aufwandmenge von 500 g/ha angewandt wird.

Patentansprüche

- ## 15 1 Substituierte 1-Aryltriazolinone der allgemeinen Formel (I)



in welchen

- | | | |
|----|---|--|
| | R ¹ | für Wasserstoff, Alkyl, Halogenalkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl oder Cycloalkyl steht, |
| 35 | R ² | für einen Rest der Formel -NR ⁸ R ⁹ steht, |
| | R ³ , R ⁶ und R ⁷ | unabhängig voneinander jeweils für Wasserstoff, Halogen, Amino oder Nitro stehen, |
| 40 | R ⁴ | für Wasserstoff, Halogen, Cyano, Nitro oder für einen der Reste -R ¹⁰ , -O-R ¹⁰ , -S-R ¹⁰ , -S(O)-R ¹⁰ , -SO ₂ -R ¹⁰ , -SO ₂ -OR ¹⁰ , -SO ₂ -NR ¹¹ R ¹⁰ , -CO-OR ¹⁰ , -CO-NR ¹¹ R ¹⁰ , -O-SO ₂ -R ¹⁰ , -N(R ¹¹)-SO ₂ -R ¹⁰ , -NR ¹¹ R ¹⁰ , -NH-P(O)(R ¹¹)(OR ¹⁰) oder -NH-P(O)(OR ¹¹)-(OR ¹⁰) steht. |
| 45 | R ⁵ | für Nitro, Cyano, Halogen oder Halogenalkyl steht und |
| | X | für Sauerstoff oder Schwefel steht, wobei |
| | R ⁸ | für Wasserstoff, Alkyl, Halogenalkyl, für einen Rest der Formel -CO-R ¹² oder für eine Rest der Formel -S(O) _n -R ¹² steht, |
| | R ⁹ | für Alkyl, Halogenalkyl, für einen Rest der Formel -CO-R ¹² oder für einen Rest der Formel -S(O) _n -R ¹² steht. |
| 50 | R ¹⁰ | für Wasserstoff oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkinyl, Cycloalkyl, Aryl, Arylalkyl oder Heterocyclyl steht, |
| | R ¹¹ | für Wasserstoff oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkinyl, Cycloalkyl, Arylalkyl oder Aryl steht, |
| | R ¹² | für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Cycloalkyl, Arylalkyl, Aryl oder Heterocyclyl steht und |
| 55 | n | für eine Zahl 0, 1 oder 2 steht. |
| 2. | Substituierte 1-Aryltriazolinone der allgemeinen Formel (I) gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß | |
| | R' | für Wasserstoff oder für jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkyl, Alkoxy, |

Alkylthio oder Alkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 8 Kohlenstoffatomen steht, außerdem für geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl mit 1 bis 8 Kohlenstoffatomen und 1 bis 17 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen steht oder für Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen steht,

5 R²
 R³, R⁶ und R⁷ für einen Rest der Formel -NR⁸R⁹ steht,
 unabhängig voneinander jeweils für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Amino oder Nitro stehen,

10 R⁴ für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Cyano, Nitro, oder für einen der Reste -R¹⁰, -O-R¹⁰, -S-R¹⁰, -S(O)-R¹⁰, -SO₂-R¹⁰, -SO₂-OR¹⁰, -SO₂-NR¹¹R¹⁰, -CO-OR¹⁰, -CO-NR¹¹R¹⁰, -O-SO₂-R¹⁰, -N(R¹¹)-SO₂-R¹⁰, -NR¹¹R¹⁰, -NH-P(O)(R¹¹)(OR¹⁰) oder -NH-P(O)(OR¹¹)(OR¹⁰) steht,

15 R⁵ für Nitro, Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Iod oder für geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 13 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen steht und

20 X für Sauerstoff oder Schwefel steht, wobei
 R⁸ für Wasserstoff, für geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit 1 bis 8 Kohlenstoffatomen oder für geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl mit 1 bis 8 Kohlenstoffatomen und 1 bis 17 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen steht und außerdem für einen Rest der Formel -CO-R¹² oder für einen Rest der Formel -S-(O)_n-R¹² steht,

25 R⁹ für geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit 1 bis 8 Kohlenstoffatomen oder für geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl mit 1 bis 8 Kohlenstoffatomen und 1 bis 17 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen steht und außerdem für einen Rest der Formel -CO-R¹² oder für einen Rest der Formel -S(O)_n-R¹² steht,

30 R¹⁰ für Wasserstoff steht;
 R¹⁰ außerdem für gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden substituiertes, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit 1 bis 14 Kohlenstoffatomen steht, wobei als Substituenten infrage kommen:
 Halogen - insbesondere Fluor, Chlor, Brom und/oder Iod -, Cyano, Carboxyl, Carbamoyl, jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy, Alkoxyalkoxy, Alkyltio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl, Alkoxy carbonyl, N-Alkylaminocarbonyl, N,N-Dialkylaminocarbonyl oder Alkylsulfonylaminocarbonyl mit jeweils 1 bis 8 Kohlenstoffatomen in den einzelnen Alkylteilen oder Heterocyclyl, wobei als Heterocyclylrest ein fünf- bis siebengliedriger, gegebenenfalls benzannellierter, gesättigter oder ungesättigter Heterocyclus mit 1 bis 3 gleichen oder verschiedenen Heteroatomen

35 R¹⁰ - insbesondere Stickstoff, Sauerstoff und/oder Schwefel - steht;
 R¹⁰ außerdem für jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen - insbesondere Fluor, Chlor, Brom und/oder Iod - substituiertes Alkenyl oder Alkinyl mit jeweils 2 bis 8 Kohlenstoffatomen steht;

40 R¹⁰ außerdem für gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen - insbesondere Fluor, Chlor, Brom und/oder Iod - und/oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen substituiertes Cycloalkyl mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen steht;

45 R¹⁰ außerdem für jeweils gegebenenfalls im Arylteil einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden substituiertes Arylalkyl oder Aryl mit jeweils 6 bis 10 Kohlenstoffatomen im Arylteil und gegebenenfalls 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im geradkettigen oder verzweigten Alkylteil steht, oder für einen gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden substituierten und/oder benzannellierten, gesättigten oder ungesättigten, fünf- bis siebengliedrigen Heterocyclylrest mit 1 bis 3 gleichen oder verschiedenen Heteroatomen - insbesondere Stickstoff, Sauerstoff und/oder Schwefel - steht, wobei als Aryl- bzw. Heterocyclylsubstituenten jeweils infrage kommen:

50 R¹⁰ Halogen, Cyano, Nitro, Amino, N-Acetyl amino, jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkyl, Alkoxy, Alkyltio, Alkylsulfinyl oder Alkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen, jeweils geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Halogenalkylthio, Halogenalkylsulfinyl oder Halogenalkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 13 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen, jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy carbonyl oder Alko-

| | | |
|----|-----------------|--|
| | R ¹¹ | ximinoalkyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den einzelnen Alkylteilen sowie gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen und/oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl oder Alkoxy mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen und/oder geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl oder Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 13 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen substituiertes Phenyl; für Wasserstoff steht; |
| 5 | R ¹¹ | außerdem für gegebenenfalls einfache oder mehrfach, gleich oder verschiedene substituiertes, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit 1 bis 14 Kohlenstoffatomen steht, wobei als Substituenten infrage kommen: |
| 10 | | Halogen - insbesondere Fluor, Chlor, Brom und/oder Iod -, Cyano, Carboxyl, Carbamoyl, jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy, Alkoxyalkoxy, Alkythio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl, Alkoxycarbonyl, N-Alkylaminocarbonyl, N,N-Dialkylaminocarbonyl oder Alkylsulfonylaminocarbonyl mit jeweils 1 bis 8 Kohlenstoffatomen in den einzelnen Alkylteilen oder Heterocycl, wobei als Heterocyclrest ein fünf- bis siebengliedriger, gegebenenfalls benzannellierter, gesättigter oder ungesättigter Heterocyclus mit 1 bis 3 gleichen oder verschiedenen Heteroatomen |
| 15 | | - insbesondere Stickstoff, Sauerstoff und/oder Schwefel - steht; |
| 20 | R ¹¹ | außerdem für jeweils gegebenenfalls einfache oder mehrfach, gleich oder verschiedene durch Halogen - insbesondere Fluor, Chlor, Brom und/oder Iod - substituiertes <u>Alkenyl</u> oder <u>Alkinyl</u> mit jeweils 2 bis 8 Kohlenstoffatomen steht; |
| 25 | R ¹¹ | außerdem für gegebenenfalls einfache oder mehrfach, gleich oder verschiedene durch Halogen - insbesondere Fluor, Chlor, Brom und/oder Iod - und/oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen substituiertes <u>Cycloalkyl</u> mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen steht; |
| 30 | R ¹¹ | außerdem für jeweils gegebenenfalls und Arylteil einfache oder mehrfach, gleich oder verschiedene substituiertes <u>Arylalkyl</u> oder <u>Aryl</u> mit jeweils 6 bis 10 Kohlenstoffatomen im Arylteil und gegebenenfalls 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im geradkettigen oder verzweigten Alkylteil steht, wobei als Arylsubstituenten jeweils infrage kommen: |
| 35 | | Halogen, Cyano, Nitro, Amino, N-Acetylarnino, jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkyl, Alkoxy, Alkythio, Alkylsulfinyl oder Alkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen, jeweils geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Halogenalkylthio, Halogenalkylsulfinyl oder Halogenalkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 13 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen, jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkoxycarbonyl oder Alkoximinoalkyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den einzelnen Alkylteilen sowie gegebenenfalls einfache oder mehrfach, gleich oder verschiedene durch Halogen und/oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl oder Alkoxy mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen und/oder geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl oder Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 13 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen substituiertes Phenyl; |
| 40 | R ¹² | für gegebenenfalls einfache oder mehrfach, gleich oder verschiedene substituiertes, geradkettiges oder verzweigtes <u>Alkyl</u> mit 1 bis 8 Kohlenstoffatomen steht, wobei als Substituenten infrage kommen: |
| 45 | | Halogen - insbesondere Fluor, Chlor, Brom und/oder Iod -, Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen oder Heterocycl, wobei als Heterocyclrest ein fünf- bis siebengliedriger, gegebenenfalls benzannellierter, gesättigter oder ungesättigter Heterocyclus mit 1 bis 3 gleichen oder verschiedenen Heteroatomen - insbesondere Stickstoff, Sauerstoff und/oder Schwefel - steht; |
| 50 | R ¹² | außerdem für gegebenenfalls einfache oder mehrfach, gleich oder verschiedene durch Halogen - insbesondere Fluor, Chlor, Brom und/oder Iod - und/oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen substituiertes <u>Cycloalkyl</u> mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen steht; |
| 55 | R ¹² | außerdem für jeweils gegebenenfalls im Arylteil einfache oder mehrfach, gleich oder verschiedene substituiertes <u>Arylalkyl</u> oder <u>Aryl</u> mit jeweils 6 bis 10 Kohlenstoffatomen im Arylteil und gegebenenfalls 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im geradkettigen oder verzweigten Alkylteil steht oder für einen gegebenenfalls einfache |

oder mehrfach, gleich oder verschieden substituierten und oder benzannellierten, gesättigten oder ungesättigten, fünf- bis siebengliedrigen Heterocyclrest mit 1 bis 3 gleichen oder verschiedenen Heteroatomen - insbesondere Stickstoff, Sauerstoff und oder Schwefel - steht, wobei als Aryl- bzw. Heterocyclsubstituenten jeweils infrage kommen:

Halogen, Cyano, Nitro, Amino, N-Acetylarnino, jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl oder Alkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen, jeweils geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Halogenalkylthio, Halogenalkylsulfinyl oder Halogenalkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 13 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen, jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy carbonyl oder Alkoximinoalkyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den einzelnen Alkylteilen sowie gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen und/oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl oder Alkoxy mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen und/oder geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl oder Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 13 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen substituiertes Phenyl und für eine Zahl 0, 1 oder 2 steht.

- 20 3. Substituierte 1-Aryltriazolinone der allgemeinen Formel (I) gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß

R¹ für Wasserstoff oder für jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkyl Alkoxy, Alkylthio oder Alkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen steht, außerdem für geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 13 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen - insbesondere Fluor, Chlor oder Brom - steht oder für Cycloalkyl mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen steht,

R² für einen Rest der Formel -NR⁸R⁹ steht,
R³, R⁶ und R⁷ unabhängig voneinander jeweils für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Amino oder Nitro stehen,

R⁴ für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Nitro, oder für einen der Reste -R¹⁰, -O-R¹⁰, -S-R¹⁰, -S(O)-R¹⁰, -SO₂-R¹⁰, -SO₂-OR¹⁰, -SO₂-NR¹¹R¹⁰, -CO-OR¹⁰, -CO-NR¹¹R¹⁰, -O-SO₂-R¹⁰, -N(R¹¹)-SO₂-R¹⁰, -NR¹¹R¹⁰, -NH-P(O)(R¹¹)(OR¹⁰) oder -NH-P(O)(OR¹¹)(OR¹⁰) steht,

R⁵ für Nitro, Cyano, Fluor, Chlor, Brom oder für geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 9 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen - insbesondere Fluor, Chlor oder Brom - steht und

X für Sauerstoff oder Schwefel steht, wobei

R⁸ für Wasserstoff, für geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen oder für geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 13 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen - insbesondere Fluor, Chlor oder Brom - steht und außerdem für einen Rest der Formel -CO-R¹² oder für einen Rest der Formel -S(O)-R¹² steht,

R⁹ für geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen oder für geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 13 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen - insbesondere Fluor, Chlor oder Brom - steht und außerdem für einen Rest der Formel -CO-R¹² oder für einen Rest der Formel -S(O)_n-R¹² steht,

R¹⁰ für Wasserstoff steht;
R¹⁰ außerdem für gegebenenfalls einfach oder zweifach, gleich oder verschieden substituiertes, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit 1 bis 12 Kohlenstoffatomen steht, wobei als Substituenten infrage kommen:

Cyano, Carboxyl, Carbamoyl, jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy, Alkoxyalkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl, Alkoxy carbonyl, N-Alkylarnino carbonyl, N,N-Dialkylaminocarbonyl oder Alkylsulfonylaminocarbonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den einzelnen Alkylteilen oder Heterocycl, wobei als Heterocyclrest ein fünf- bis siebengliedriger, gegebenenfalls benzannellierte, gesättigter oder ungesättigter Heterocyclus mit 1 bis 3 gleichen oder verschiedenen Heteroatomen - insbesondere Stickstoff, Sauerstoff und/oder Schwefel - steht;

| | | |
|----|-----------------|--|
| | R ⁸ | außerdem für geradkettiges oder verzweigtes <u>Halogenalkyl</u> mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 13 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen - insbesondere Fluor, Chlor und/oder Brom - steht; |
| 5 | R ¹⁰ | außerdem für jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach, gleich oder verschieden durch Halogen - insbesondere Fluor, Chlor und/oder Brom - substituiertes <u>Alkenyl</u> oder <u>Alkinyl</u> mit jeweils 2 bis 6 Kohlenstoffatomen steht; |
| 10 | R ¹⁰ | außerdem für gegebenenfalls einfach bis dreifach, gleich oder verschieden durch Halogen - insbesondere Fluor, Chlor und/oder Brom - und/oder geradkettiges oder verzweigtes <u>Alkyl</u> mit 1 bis 3 Kohlenstoffatomen substituiertes <u>Cycloalkyl</u> mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen steht; |
| 15 | R ¹⁰ | außerdem für jeweils gegebenenfalls im Phenylteil einfach bis fünffach, gleich oder verschieden substituiertes <u>Phenylalkyl</u> oder <u>Phenyl</u> mit gegebenenfalls 1 bis 3 Kohlenstoffatomen im geradkettigen oder verzweigten Alkylteil steht, oder für einen gegebenenfalls einfach bis dreifach, gleich oder verschieden substituierten und/oder benzannellierten, gesättigten oder ungesättigten, fünf- bis siebengliedrigen <u>Heterocyclrest</u> mit 1 bis 3 gleichen oder verschiedenen Heteroatomen - insbesondere Stickstoff, Sauerstoff und/oder Schwefel - steht, wobei als Phenyl- bzw. Heterocyclsubstituenten jeweils infrage kommen: |
| 20 | | Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Nitro, Amino, N-Acetylarnino, jeweils geradkettiges oder verzweigtes <u>Alkyl</u> , <u>Alkoxy</u> , <u>Alkylthio</u> , <u>Alkylsulfinyl</u> oder <u>Alkylsulfonyl</u> mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, jeweils geradkettiges oder verzweigtes <u>Halogenalkyl</u> , <u>Halogenalkoxy</u> , <u>Halogenalkylthio</u> , <u>Halogenalkylsulfinyl</u> oder <u>Halogenalkylsulfonyl</u> mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 9 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen, jeweils geradkettiges oder verzweigtes <u>Alcoxycarbonyl</u> oder <u>Alkoximinoalkyl</u> mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen in den einzelnen Alkylteilen sowie gegebenenfalls einfach bis fünffach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom und/oder geradkettiges oder verzweigtes <u>Alkyl</u> oder <u>Alkoxy</u> mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und/oder geradkettiges oder verzweigtes <u>Halogenalkyl</u> oder <u>Halogenalkoxy</u> mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 9 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen substituiertes <u>Phenyl</u> ; |
| 25 | | für Wasserstoff steht; |
| 30 | R ¹¹ | außerdem für gegebenenfalls einfach oder zweifach, gleich oder verschieden substituiertes, geradkettiges oder verzweigtes <u>Alkyl</u> mit 1 bis 12 Kohlenstoffatomen steht, wobei als Substituenten infrage kommen: |
| 35 | R ¹¹ | Cyano, Carboxyl, Carbamoyl, jeweils geradkettiges oder verzweigtes <u>Alkoxy</u> , <u>Alkoxyalkoxy</u> , <u>Alkylthio</u> , <u>Alkylsulfinyl</u> , <u>Alkylsulfonyl</u> , <u>Alcoxycarbonyl</u> , <u>N-Alkylamino-carbonyl</u> , <u>N,N-Dialkylaminocarbonyl</u> oder <u>Alkylsulfonylaminocarbonyl</u> mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den einzelnen Alkylteilen oder <u>Heterocycl</u> , wobei als <u>Heterocyclrest</u> ein fünf- bis siebengliedriger, gegebenenfalls benzannellierte, gesättigter oder ungesättigter Heterocyclus mit 1 bis 3 gleichen oder verschiedenen Heteroatomen - insbesondere Stickstoff, Sauerstoff und/oder Schwefel - steht; |
| 40 | R ¹¹ | außerdem für geradkettiges oder verzweigtes <u>Halogenalkyl</u> mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 13 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen - insbesondere Fluor, Chlor und/oder Brom - steht; |
| 45 | R ¹¹ | außerdem für jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach, gleich oder verschieden durch Halogen - insbesondere Fluor, Chlor und/oder Brom - substituiertes <u>Alkenyl</u> oder <u>Alkinyl</u> mit jeweils 2 bis 6 Kohlenstoffatomen steht; |
| 50 | R ¹¹ | außerdem für gegebenenfalls einfach bis dreifach, gleich oder verschieden durch Halogen - insbesondere Fluor, Chlor und/oder Brom - und/oder geradkettiges oder verzweigtes <u>Alkyl</u> mit 1 bis 3 Kohlenstoffatomen substituiertes <u>Cycloalkyl</u> mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen steht; |
| 55 | R ¹¹ | außerdem für jeweils gegebenenfalls im Phenylteil einfach bis fünffach, gleich oder verschieden substituiertes <u>Phenylalkyl</u> oder <u>Phenyl</u> mit gegebenenfalls 1 bis 3 Kohlenstoffatomen im geradkettigen oder verzweigten Alkylteil steht, wobei als Phenylsubstituenten jeweils infrage kommen: |
| | | Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Nitro, Amino, N-Acetylarnino, jeweils geradkettiges oder verzweigtes <u>Alkyl</u> , <u>Alkoxy</u> , <u>Alkylthio</u> , <u>Alkylsulfinyl</u> oder <u>Alkylsulfonyl</u> mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, jeweils geradkettiges oder verzweigtes Haloge- |

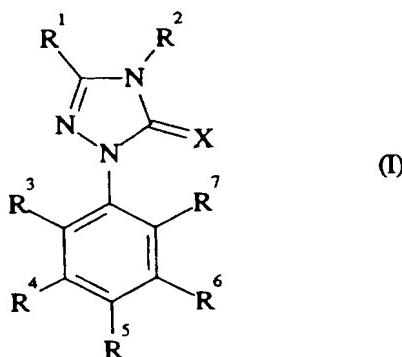
| | | |
|----|-----------------|--|
| | | nalkyl, Halogenalkoxy, Halogenalkylthio, Halogenalkylsulfinyl oder Halogenalkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 9 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen, jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy carbonyl oder Alkoximinoalkyl mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen in den einzelnen Alkylteilen sowie gegebenenfalls einfach bis fünffach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom und/oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl oder Alkoxy mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und/oder geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl oder Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 9 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen substituiertes Phenyl; für gegebenenfalls einfach oder zweifach, gleich oder verschieden substituiertes, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit 1 bis 12 Kohlenstoffatomen steht, wobei als Substituenten infrage kommen: |
| 5 | | Cycloalkyl mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen oder Heterocyclyl, wobei als Heterocyclrest ein fünf- bis siebengliedriger, gegebenenfalls benzannellierter, gesättigter oder ungesättigter Heterocyclus mit 1 bis 3 gleichen oder verschiedenen Heteroatomen - insbesondere Stickstoff, Sauerstoff und/oder Schwefel - steht; |
| 10 | R ¹² | außerdem für geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 13 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen - insbesondere Fluor, Chlor und/oder Brom - steht, |
| 15 | R ¹² | außerdem für gegebenenfalls einfach bis dreifach, gleich oder verschieden durch Halogen - insbesondere Fluor, Chlor und/oder Brom - und/oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit 1 bis 3 Kohlenstoffatomen substituiertes Cycloalkyl mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen steht; |
| 20 | R ¹² | außerdem für jeweils gegebenenfalls im Phenylteil einfach bis fünffach, gleich oder verschieden substituiertes Phenylalkyl der Phenyl mit gegebenenfalls 1 bis 3 Kohlenstoffatomen im geradkettigen oder verzweigten Alkylteil steht, oder für einen gegebenenfalls einfach bis dreifach, gleich oder verschieden substituierten und/oder benzannellierten, gesättigten oder ungesättigten, fünf- bis siebengliedrigen Heterocyclrest mit 1 bis 3 gleichen oder verschiedenen Heteroatomen - insbesondere Stickstoff, Sauerstoff und/oder Schwefel - steht, wobei als Phenyl- bzw. Heterocyclsubstituenten jeweils infrage kommen: |
| 25 | R ¹² | Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Nitro, Amino, N-Acetylarnino, jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl oder Alkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, jeweils geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Halogenalkylthio, Halogenalkylsulfinyl oder Halogenalkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 9 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen, jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy carbonyl oder Alkoximinoalkyl mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen in den einzelnen Alkylteilen sowie gegebenenfalls einfach bis fünffach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom und/oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl oder Alkoxy mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und/oder geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl oder Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 9 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen substituiertes Phenyl und |
| 30 | | für eine Zahl 0, 1 oder 2 steht. |
| 35 | | |
| 40 | | |
| 45 | n | |

4. Verfahren zur Herstellung substituierter 1-Aryltriazolinone der allgemeinen Formel (I).

50

55

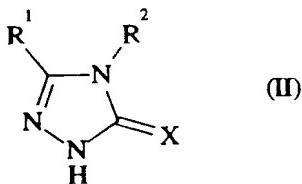
5



10

- 15 in welcher
 R¹ für Wasserstoff, Alkyl, Halogenalkyl, Alkoxy, Alkylothio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl oder Cycloalkyl steht,
 R² für einen Rest der Formel -NR⁸R⁹ steht,
 R³, R⁶ und R⁷ unabhängig voneinander jeweils für Wasserstoff, Halogen, Amino oder Nitro stehen,
 20 R⁴ für Wasserstoff, Halogen, Cyano, Nitro oder für einen der Reste -R¹⁰, -O-R¹⁰, -S-R¹⁰, -S(O)-R¹⁰, -SO₂-R¹⁰, -SO₂-OR¹⁰, -SO₂-NR¹¹R¹⁰, -CO-OR¹⁰, -CO-NR¹¹R¹⁰, -O-SO₂-R¹⁰, -N(R¹¹)-SO₂-R¹⁰, -NR¹¹R¹⁰, -NH-P(O)(R¹¹)(OR¹⁰) oder -NH-P(O)(OR¹¹)-(OR¹⁰) steht,
 25 R⁵ für Nitro, Cyano, Halogen oder Halogenalkyl steht und
 X für Sauerstoff oder Schwefel steht, wobei
 R⁸ für Wasserstoff, Alkyl, Halogenalkyl, für einen Rest der Formel -CO-R¹² oder für eine Rest der Formel -S(O)_n-R¹² steht,
 R⁹ für Alkyl, Halogenalkyl, für einen Rest der Formel -CO-R¹² oder für einen Rest der Formel -S(O)_n-R¹² steht,
 30 R¹⁰ für Wasserstoff oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkinyl, Cycloalkyl, Aryl, Arylalkyl oder Heterocyclyl steht,
 R¹¹ für Wasserstoff oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkinyl, Cycloalkyl, Arylalkyl oder Aryl steht,
 35 R¹² für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Cycloalkyl, Aryl, Arylalkyl oder Heterocyclyl steht und
 n für eine Zahl 0, 1 oder 2 steht,
 dadurch gekennzeichnet, daß man
- a) 1H-Triazolinone der Formel (II),

40

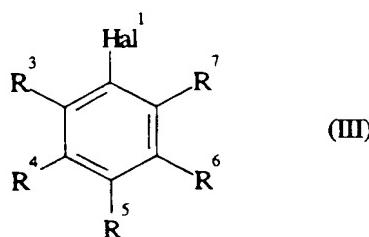


45

- 50 in welcher
 R¹, R² und X die oben angegebene Bedeutung haben,
 mit Halogenbenzol-Derivaten der Formel (III),

55

5



10

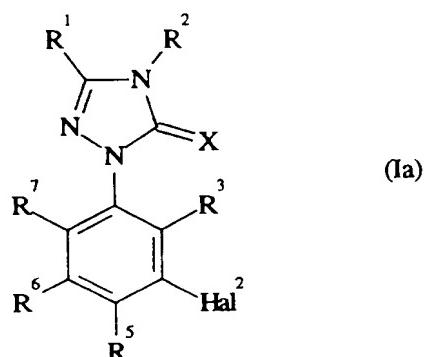
in welcher

R³, R⁴, R⁵, R⁶ und R⁷ die oben angegebenen Bedeutungen haben und
Hal¹ für Halogen steht,

15 gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Reaktionshilfsmittels umsetzt, oder daß man

b) substituierte 1-Aryltriazolinone der Formel (Ia),

20



25

30

in welcher

R¹, R², R³, R⁶, R⁵, R⁷ und X die oben angegebenen Bedeutungen haben und

35 Hal² für Halogen steht,
mit Nukleophilen der Formel (IV),

H-R¹³ (IV)

40

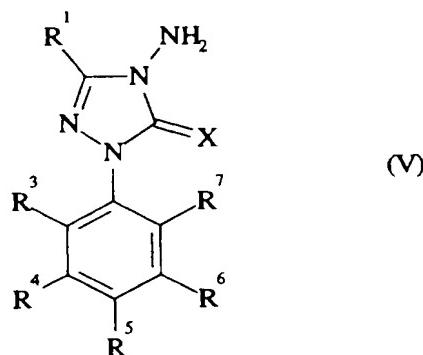
in welcher

R¹³ für einen Rest der Formel -O-R¹⁰, -S-R¹⁰ oder -NR¹¹R¹⁰ steht,
wobei

45 R¹⁰ und R¹¹ die oben angegebenen Bedeutungen haben,
gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Reaktionshilfsmittels umsetzt, oder daß man
c) substituierte Triazolinone der Formel (V),

50

55

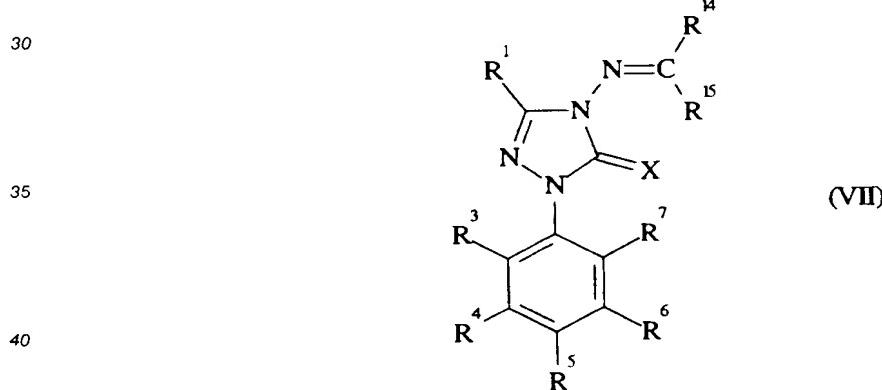


in welcher
 $R^1, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7$ und X die oben angegebenen Bedeutungen haben,
 mit Alkylierungs-, Acylierungs- oder Sulfonylierungsmitteln der Formel (VI),

R^8 -E (VI)

20

in welcher
 R^9 die oben angegebene Bedeutung hat und
 E für eine elektronenanziehende Abgangsgruppe steht,
 gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines
 25 Reaktionshilfsmittels umgesetzt, oder daß man
 d) 4-Alkylidenimino-triazolinone der Formel (VII),



in welcher
 $R^1, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7$ und X die oben angegebenen Bedeutungen haben,
 R^{14} für Wasserstoff oder Alkyl steht und
 R^{15} für Alkyl oder Alkoxy steht,
 mit einem Reduktionsmittel gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Reaktionshilfsmittels umgesetzt.

50

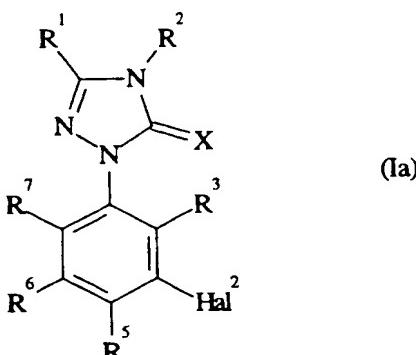
5. Herbizide Mittel, gekennzeichnet durch einen Gehalt an mindestens einem substituierten 1-Aryltriazolinon der Formel (I) gemäß den Ansprüchen 1 bis 4.
6. Verfahren zur Bekämpfung von unerwünschten Pflanzen, dadurch gekennzeichnet, daß man substituierte 1-Aryltriazolinone der allgemeinen Formel (I) gemäß den Ansprüchen 1 bis 4 auf Pflanzen und/oder ihren Lebensraum einwirken läßt.

7. Verwendung von substituierten 1-Aryltriazolinonen der allgemeinen Formel (I) gemäß der Ansprüche 1 bis 4 zur Bekämpfung von unerwünschten Pflanzen.

8. Verfahren zur Herstellung von herbiziden Mitteln, dadurch gekennzeichnet, daß man substituierte 1-Aryltriazolinone der allgemeinen Formel (I) gemäß der Ansprüche 1 bis 4 mit Streckmitteln und/oder oberflächenaktiven Substanzen vermischt.

9. Substituierte 1-Aryltriazolinone der Formel (Ia)

10



15

20

in welcher

25 R¹ für Wasserstoff, Alkyl, Halogenalkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl oder Cycloalkyl steht,

R² für einen Rest der Formel-NR⁸R⁹ steht,

R³, R⁶ und R⁷ unabhängig voneinander jeweils für Wasserstoff, Halogen, Amino oder Nitro stehen,

30 R⁵ für Nitro, Cyano, Halogen oder Halogenalkyl steht und

X für Sauerstoff oder Schwefel steht, wobei

R⁸ für Wasserstoff, Alkyl, Halogenalkyl, für einen Rest der Formel-CO-R¹² oder für einen Rest der Formel-S(O)_n-R¹² steht,

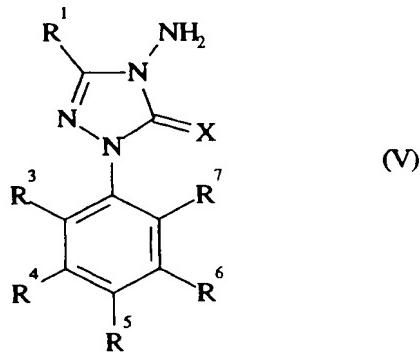
R⁹ für Alkyl, Halogenalkyl, für einen Rest der Formel-CO-R¹² oder für einen Rest der Formel-S(O)_n-R¹² steht,

35 und Hal² für Halogen steht.

40

10. Substituierte Triazolinone der Formel (V)

45



50

in welcher

55 R¹ für Wasserstoff, Alkyl, Halogenalkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl oder Cycloalkyl steht,

R³, R⁶ und R⁷ unabhängig voneinander jeweils für Wasserstoff, Halogen, Amino oder Nitro stehen,

| | | |
|----|-----------------|--|
| | R ⁴ | für Wasserstoff, Halogen, Cyano, Nitro oder für einen der Reste -R ¹⁰ , -O-R ¹⁰ , -S-R ¹⁰ , -S(O)-R ¹⁰ , -SO ₂ -R ¹⁰ , -SO ₂ -OR ¹⁰ , -SO ₂ -NR ¹¹ R ¹⁰ , -CO-OR ¹⁰ , -CO-NR ¹¹ R ¹⁰ , -O-SO ₂ -R ¹⁰ , -N(R ¹¹)-SO ₂ -R ¹⁰ , -NR ¹¹ R ¹⁰ , -NH-P(O)(R ¹¹)(OR ¹⁰) oder -NH-P(O)(OR ¹¹)-(OR ¹⁰) steht, |
| 5 | R ⁵ | für Nitro, Cyano, Halogen oder Halogenalkyl steht und |
| | X | für Sauerstoff oder Schwefel steht, wobei |
| | R ¹⁰ | für Wasserstoff oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkinyl, Cycloalkyl, Aryl, Arylalkyl oder Heterocyclyl steht, |
| 10 | R ¹¹ | für Wasserstoff oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkinyl, Cycloalkyl, Arylalkyl oder Aryl steht, |
| | n | für eine Zahl 0, 1 oder 2 steht. |

15

20

25

30

35

40

45

50

55



Europäisches
Patentamt

EUROPÄISCHER RECHERCHENBERICHT

Nummer der Anmeldung
EP 94 10 3880

| EINSCHLÄGIGE DOKUMENTE | | | |
|--|---|---|--|
| Kategorie | Kennzeichnung des Dokuments mit Angabe, soweit erforderlich, der maßgeblichen Teile | Betrieb Anspruch | KLASSIFIKATION DER ANMELDUNG (Int.CLS) |
| D, Y | DE-A-38 39 480 (BAYER AG) 31. Mai 1990 * das ganze Dokument * --- | 1-10 | C07D249/14 C07D401/12 C07D405/12 C07D409/12 A01N43/653 |
| Y | WO-A-86 04481 (FMC CORPORATION) 14. August 1986 * das ganze Dokument * --- | 1-10 | |
| X | DE-A-31 31 982 (HOECHST AG) 24. Februar 1983 *siehe Formel I und Beispiel 4, Seite 9* --- | 10 | |
| Y | | 1-10 | |
| Y | Z. NATURFORSCHUNG, TEIL C Bd. 29C, Nr. 5/6 , 1974 Seiten 232 - 235 A.TREBST ET AL 'Herbicidal N-Alkylated Ureas and Ring closed N-Acylamides as Inhibitors of Photosystem II' ----- | 1-10 | |
| | | | RECHERCHIERTE SACHGEBIETE (Int.Cl.5) |
| | | | C07D A01N |
| Der vorliegende Recherchenbericht wurde für alle Patentansprüche erstellt | | | |
| Recherchesort | Abschlußdatum der Recherche | Prüfer | |
| MÜNCHEN | 28. Juni 1994 | Scruton-Evans, I | |
| KATEGORIE DER GENANNTEN DOKUMENTE | | T : der Erfindung zugrunde liegende Theorien oder Grundsätze E : älteres Patentdokument, das jedoch erst am oder nach dem Anmeldedatum veröffentlicht worden ist D : in der Anmeldung angeführtes Dokument L : aus andern Gründen angeführtes Dokument ----- & : Mitglied der gleichen Patentfamilie, übereinstimmendes Dokument | |
| X : von besonderer Bedeutung allein betrachtet Y : von besonderer Bedeutung in Verbindung mit einer anderen Veröffentlichung derselben Kategorie A : technologischer Hintergrund O : nichtschriftliche Offenbarung P : Zwischenliteratur | | | |